



H U 0 0 0 2 2 0 2 7 7 B

(19) Országkód

HU

MAGYAR
KÖZTÁRSASÁGMAGYAR
SZABADALMI
HIVATALSZABADALMI
LEÍRÁS

(21) A bejelentés ügyszáma: P 99 01927

(22) A bejelentés napja: 1999. 06. 09.

(30) Elsőbbségi adatok:

10-160437 1998. 06. 09. JP

(40) A közzététel napja: 2000. 05. 29.

(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi
Közlönyben: 2001. 11. 28.

(11) Lajstromszám:

220 277 B

(51) Int. Cl.⁷

C 07 C 251/32

A 01 N 53/00

(72) Feltaláló:

Ujihara, Kazuya, Aoba-ku, Yokohama-shi (JP)

(73) Szabadalmas:

Sumitomo Chemical Co. Ltd., Osaka (JP)

(74) Képviselő:

dr. Gárdonyi Zoltánné, DANUBIA Szabadalmi
és Védjegy Iroda Kft., Budapest

(54)

Inszekticid hatású
oximino-szubsztituált ciklopropánkarboxilát-származékok,
és alkalmazásuk

KIVONAT

A találmány észtervegyületekre és kártevők, különösen rovarok és atkák ellen használható kompozíciókra vonatkozik, amelyek hatóanyagként ilyen vegyületeket tartalmaznak.

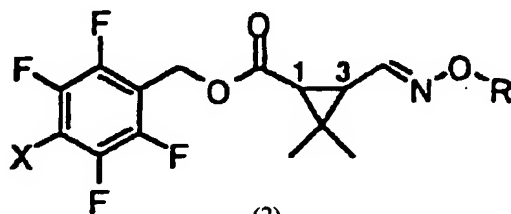
A találmány szerinti észtervegyületek a (2) általános képletnek felelnek meg, ahol

R jelentése hidrogénatom, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 1–3 szénatomos alkilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített allilcsoport vagy helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített propargilcsoport,

X jelentése hidrogénatom, halogénatom, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesi-

tett 1–3 szénatomos alkilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 2–3 szénatomos alkenilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 2–3 szénatomos alkinilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 1–3 szénatomos alkoxycsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 1–3 szénatomos alkil-tio-csoport vagy (1–3 szénatomos alkoxi)-metilcsoport, amely helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített az alkoxirészben.

A találmány szerinti inszekticid kompozíciók hatóanyagként egy (2) általános képletű észtervegyületet tartalmaznak.



(2)

A találmány észtervegyületekre és kártevők ellen használható kompozíciókra vonatkozik, amelyek hatóanyagként ilyen vegyületeket tartalmaznak.

A 4 219 565 számú USA szabadalmi leírásból ismert, hogy 2,2-dimetil-3-(oximinometil)ciklopropán-karbonsav-benzil-észterek inszekticid és/vagy akaricid hatással rendelkeznek.

Ezeknek a vegyületeknek az inszekticid és/vagy akaricid hatása azonban a gyakorlatban nem elégséges.

Mélyreható vizsgálatokat folytattunk kielégítő kártevőirtó hatású vegyületek felkutatására, és azt találtuk, hogy a (2) általános képletű észtervegyületek kitűnő kártevőellenes hatást mutatnak.

Az említett felismerés alapján a találmány (2) általános képletű észtervegyületekre vonatkozik, amelyek képletében

R jelentése hidrogénatom, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 1–3 szénatomos alkilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített allilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített propargilcsoport,

X jelentése hidrogénatom, halogénatom, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 1–3 szénatomos alkilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 2–3 szénatomos alkenilcsoport, helyettesített vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített alkinilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 1–3 szénatomos alkoxilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 1–3 szénatomos alkil-tio-csoport vagy (1–3 szénatomos alkoxi)metil-csoport, amely helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített az alkoxirészben.

Ezeket az észtervegyületeket a továbbiakban találmány szerinti vegyületeknek nevezzük. A találmány tárgyát képezik továbbá kártevők ellen használható kompozíciók, amelyek hatóanyagként egy találmány szerinti vegyületet tartalmaznak.

A találmány szerinti vegyületekben a halogénatom fluoratom, klóratom, brómatom vagy más halogénatom. Az 1–3 szénatomos alkilcsoport, amely helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal van helyettesítve, lehet például metilcsoport, etilcsoport, trifluor-metil-csoport. A helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített allilcsoport lehet például allilcsoport, 2-klór-allil-csoport, 3-klór-allil-csoport. A helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített propargilcsoport lehet például propargilcsoport, 3-klór-propargil-csoport, 3-jód-propargil-csoport. A 2–3 szénatomos, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített alkenilcsoport egyebek között lehet allilcsoport. A helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 2–3 szénatomos alkinilcsoportra példaként megemlíthetjük a propargilcsoportot. A helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 1–3 szénatomos alkoxilcsoport lehet például metoxilcsoport, trifluor-metoxi-csoport. A helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal he-

lyettesített 1–3 szénatomos alkil-tio-csoport lehet, például metil-tio-csoport. Az (1–3 szénatomos alkoxi)metilcsoport, amelyben az alkoxilcsoport 1–3 szénatomos és helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal van helyettesítve, lehet például metoxi-metil-csoport.

A találmány szerinti vegyületeket például a következő eljárásokkal állíthatjuk elő.

A) előállítási eljárás

Ezzel az eljárással a találmány szerinti vegyületeket oly módon állítjuk elő, hogy egy (3) általános képletű karbonsavat, ahol R jelentése a fenti, vagy annak egy reakcióképes származékát egy (4) általános képletű alkoholvegyülettel, ahol X jelentése a fenti, vagy annak egy reakcióképes származékával reagáltatunk.

A reakciót rendszerint egy szerves oldószerben hajtjuk végre, adott esetben egy reakciót elősegítő anyag jelenlétében, miközben a reakcióelegyből szükség esetén eltávolítjuk a melléktermékeket.

A reakció ideje 5 perctől 72 óráig terjed. A reakció hőmérséklete általában -80°C és a reakcióhoz használt oldószer forráspontja vagy $+200^{\circ}\text{C}$ között változik.

A (3) általános képletű karbonsav reakcióképes származékaként használhatjuk annak savhalogénidjét, savanhidridjét, 1–4 szénatomos alkil-észtereit vagy más reakcióképes származékát.

A (4) általános képletű alkoholvegyület reakcióképes származékaként használhatjuk annak halogénidjeit, szulfonsavésztereit, kvaterner ammóniumsóit vagy más reakcióképes származékát.

Noha a (3) általános képletű karbonsav vagy a vegyület reakcióképes származékának a (4) általános képletű alkoholvegyülethez vagy annak reakcióképes származékához viszonyított molarányát szabadon megválaszthatjuk, előnyösen ekvimoláris vagy közel ekvimoláris mennyiségben használjuk ezeket a vegyületeket.

A reakciót elősegítő anyag lehet például tercier amin, mint trietil-amin, 4-(dimetil-amino)piridin, diizopropil-amin vagy más hasonló vegyület, egy nitrogéntartalmú aromás vegyület, mint piridin vagy más hasonló vegyület, egy szerves bázis, például egy alkálifém-alkoxid (például nátrium-metoxid vagy kálium-terc-butoxid) vagy más hasonló vegyület, egy szerves bázis, mint nátrium-hidroxid, kálium-karbonát, nátrium-hidrid vagy más hasonló vegyület, protonos sav, mint p-toluolszulfonsav, kénsav vagy más hasonló vegyület, egy Lewis-sav, mint titán(IV)-fenoxid vagy más hasonló vegyület, diciklohexil-karbodiimid, 1-etil-3-[3-(dimetil-amino)propil]-karbodiimid-hidroklorid, valamint egy dietil-azodikarboxilátból és trifenil-foszfintól álló reagens.

A fenti vegyületek közül a (3) általános képletű karbonsav vagy a vegyület reakcióképes származékának és a (4) általános képletű alkoholvegyület vagy a vegyület reakcióképes származékának – melyeket a reakciónak kívánunk alávetni – természetétől függően választjuk meg a reakciót elősegítő anyagot. A reakciót elősegítő anyag mennyiségét a reakció módjának figyelembevételével választjuk meg.

Oldószerként szénhidrogéneket, mint benzolt, toluolt, hexánt vagy más hasonló szénhidrogént, étereket, mint dietil-étert, tetrahidrofuránt vagy más hasonló

étert, halogénezett szénhidrogéneket, mint diklór-metánt, 1,1-diklór-etánt vagy más hasonló halogénezett szénhidrogént, amidokat, mint dimetil-formamidot vagy más hasonló amidot, ketonokat, mint acetont vagy más hasonló ketont, szerves kénvegyületeket, mint dimetil-szulfoxidot vagy más hasonló szerves kénvegyületet vagy a felsoroltak keverékeit használjuk.

A reakció befejeződése után a reakcióelegyet a szokásos módon, mint például extrakcióval, melyhez egy szerves oldószert használunk, betöményítéssel vagy más hasonló módon dolgozzuk fel, hogy a találmány szerinti vegyületet kapjuk. A találmány szerinti vegyületet például kromatográfiásan, desztillációval, átkristályosítással vagy más hasonló módon tisztíthatjuk.

A (3) általános képletű karbonsavat vagy annak reakcióképes származékát előállíthatjuk a szakirodalomban a J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 2470 (1970) közleményben vagy a JP-A-54-160 343 számú közzétételi iratban leírt eljárással. A (4) általános képletű alkoholvegyületet vagy annak reakcióképes származékát előállíthatjuk a JP-A-53-79 845, a JP-A-56-97 251, a JP-A-57-123 146 vagy a JP-A-61-207 361 számú közzétételi iratban leírt eljárással.

B) előállítási eljárás

Ezzel az eljárással a találmány szerinti vegyületet oly módon állítjuk elő, hogy egy (5) általános képletű aldehidet, ahol X jelentése a fenti, egy (6) általános képletű hidroxil-amin-vegyülettel, ahol R jelentése a fenti, vagy annak egy protonos savval képzett sójával reagáltatjuk.

A reakciót általában egy oldószemben, adott esetben egy reakciót elősegítő anyag jelenlétében hajtjuk végre.

A reakció ideje 5 perc és 72 óra között változhat, a reakció hőmérséklete pedig általában -80°C -tól a reakcióhoz használt oldószert forráspontjáig vagy $+100^{\circ}\text{C}$ -ig terjedhet.

A (6) általános képletű hidroxil-amin-vegyületet vagy annak egy protonos savval képzett sóját 1 mol (5) általános képletű aldehidre számítva általában 1 mol mennyiségben vagy fölöslegben, előnyösen 1–5 mol fölöslegben használjuk.

A hidroxil-amin-vegyület protonos savas sójaként például hidrokloridját vagy szulfátját használjuk.

Az adott esetben használt reakciót elősegítő anyag lehet például tercier amin, mint trietil-amin, 4-(dimetil-amin)piridin, diizopropil-etil-amin vagy más hasonló tercier amin, nitrogéntartalmú aromás vegyület, mint piridin vagy más hasonló vegyület, szerves bázis, mint alkálifém-alkoxid (például nátrium-metoxid) vagy egy szerves sav sója (például nátrium-acetát) és más hasonló vegyület, egy szerves bázis, mint nátrium-hidroxid, kálium-karbonát vagy más hasonló vegyület.

Oldószerként szénhidrogéneket, mint benzolt, toluolt, hexánt vagy más hasonlót, étereket, mint dietil-étert, tetrahidrofuránt vagy más hasonlót, halogénezett szénhidrogéneket, mint diklór-metánt, 1,2-diklór-etánt vagy más hasonlót, amidokat, mint dimetilformamidot vagy más hasonlót, alkoholokat, mint metanolt vagy más hasonlót, szerves kénvegyületeket, mint dimetil-szulfoxidot vagy más hasonlót, szerves savakat, mint ecetsa-

vat vagy más hasonlót vagy vizet vagy ezek keverékeit használjuk.

A reakció teljes végbemenetele után a reakcióelegyet egy szokásos feldolgozási eljárással, mint szerves oldószeres extrakcióval, betöményítéssel vagy más hasonló eljárással dolgozzuk fel, hogy megkapjuk a találmány szerinti vegyületet. A találmány szerinti vegyületet például kromatográfiásan, desztillációval vagy átkristályosítással, vagy más hasonló módon tisztíthatjuk.

Az (5) általános képletű aldehidet a JP-A-49-47 531 számú közzétételi iratban leírt eljárással állíthatjuk elő.

Az olyan találmány szerinti vegyületeket, amelyekben R nem hidrogénatom, előállíthatjuk olyan találmány szerinti vegyületekből, amelyekben R hidrogénatom, például az alábbi eljárással.

C) előállítási eljárás

Ezzel az eljárással olyan találmány szerinti vegyületeket állíthatunk elő, amelyekben R jelentése hidrogénatomtól eltérő, oly módon, hogy egy olyan találmány szerinti vegyületet, amelyben R jelentése hidrogénatom, egy (7) általános képletű vegyülettel reagáltatunk, ahol R¹ jelentése helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített 1–3 szénatomos alkilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített allilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített propargilcsoport, és L jelentése egy lehasadó csoport, mint halogénatom (például klóratom, brómatom vagy jódatom), egy helyettesítetlen vagy helyettesített alkil-szulfonil-oxi-csoport (például metánszulfonil-oxi-csoport vagy trifluor-metán-szulfonil-oxi-csoport), helyettesítetlen vagy helyettesített aril-szulfonil-oxi-csoport (például p-toluolszulfonil-oxi-csoport), helyettesítetlen vagy helyettesített alkoxiszulfonil-oxi-csoport (például metoxiszulfonil-oxi-csoport), helyettesített ammóniocsoport (például trimetil-ammóniocsoport) vagy helyettesített jodoniocsoport (például feniljodoniocsoport).

A reakciót általában egy oldószemben, adott esetben egy reakciót elősegítő anyag jelenlétében hajtjuk végre.

A reakció ideje 5 perctől 72 óráig terjedhet. A reakció hőmérséklete általában -80°C és a reakcióhoz használt oldószert forráspontja vagy $+100^{\circ}\text{C}$ között változhat.

Egy mol találmány szerinti vegyületre, amelyben R jelentése hidrogénatom, 1 mol vagy fölöslegben vett mennyiségű (7) általános képletű vegyületet használunk, előnyösen 1–5 mol fölöslegben.

A reakciót elősegítő anyag, amelyet adott esetben használunk, lehet például egy tercier amin, mint trietil-amin, 4-(dimetil-amin)piridin, diizopropil-etil-amin vagy más hasonló, egy nitrogéntartalmú aromás vegyület, mint piridin vagy más hasonló, egy szerves bázis, mint egy alkálifém-alkoxid (például kálium-terc-butoxid), egy szerves sav sója (például trifluor-metánszulfonsav ezüstsója) vagy más hasonló, egy szerves bázis, mint nátrium-hidroxid, kálium-karbonát, nátrium-hidrid vagy más hasonló.

Oldószerként használhatunk szénhidrogéneket, például benzolt, toluolt, hexánt vagy más hasonlót, étere-

ket, mint dietil-étert, tetrahydrofuránt vagy más hasonlót, halogénezett szénhidrogéneket, mint diklór-metánt, 1,2-diklór-etánt vagy más hasonlót, amidokat, mint dimetil-formamidot vagy más hasonlót, ketonokat, mint acetont vagy más hasonlót, szerves kénvegyületeket, mint dimetil-szulfoxidot vagy más hasonlót, valamint azok keverékeit.

A reakció befejeződése után a reakcióelegyet egy szokásos feldolgozási eljárással, mint extrakcióval, amelyhez egy szerves oldószert használunk, betöményítéssel vagy más módon feldolgozzuk, amikor is olyan találmány szerinti vegyületet kapunk, amelyben R jelentése hidrogénatomtól eltérő. A vegyületet például kromatográfiásan, desztillációval, átkristályosítással vagy más hasonló módon tisztíthatjuk.

A találmány szerinti vegyületeknek az aszimmetrikus szénatomjuk miatt vannak optikai izomerjei (R és S), a kettős kötésük miatt vannak geometriai (E és Z) izomerjei, a ciklopropángyűrű miatt pedig geometriai (cisz és transz) izomerjei. Az összes optikai izomer, geometriai izomer és azok keverékei, amelyeknek kártevőellenes hatásuk van, a találmány tárgyát képezik.

A (3) általános képletű karbonsav lehet például 3-(metoxi-imino-metil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarbonsav vagy 3-(etoxi-imino-metil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarbonsav.

A (4) általános képletű alkoholvegyület lehet például (2,3,5,6-tetrafluor-fenil)metanol, (2,3,4,5,6-pentafluor-fenil)metanol, (2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)metanol vagy (2,3,5,6-tetrafluor-4-metoxi-fenil)metanol.

Az (5) általános képletű aldehid lehet például (2,3,4,5,6-pentafluor-fenil)-metil-3-formil-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát, (2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)-metil-3-formil-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát vagy (2,3,5,6-tetrafluor-4-metoxi-fenil)-metil-3-formil-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát.

A (6) általános képletű hidroxil-amin-vegyület lehet például hidroxil-amin, O-metil-hidroxil-amin vagy O-etil-hidroxil-amin.

A (7) általános képletű vegyület lehet például metilklorid, etil-bromid, metil-jodid, metil-metánszulfonát, metil-p-toluolszulfonát vagy dimetil-kénsav.

A találmány szerinti vegyületek hatékonyak például az alábbi rovarkártevők (kártékony rovarok és kártékony atkák) ellen:

félfedelesszárnyúak: sarkantyús kabócák (Delphacidae), mint réti sarkantyús kabóca (*Laodelphax striatellus*), barna növényiszöcske (*Nilaparvata lugens*) és barna rizskabóca (*Sogatella furcifera*), mezei kabócák (Deltocephalidae), mint zöld rizskabócák (*Nephotettix cincticeps* és *Nephotettix virescens*), levéltetvek (Aphididae), poloskák (Pentatomidae), liszteskék (Aleyrodidae), pajzstetvek (Coccidae), csipkepoloskák (Tingidae), levélbolhafélék (Psyllidae) és más hasonlóak,

lepkék: fénylepkék (Pieridae), mint rizsszárfűró (*Chilo suppressalis*), rizslevélsodró lepke (*Cnaphalocrocis medinalis*), aszálványmoly (*Plodia interpunctella*), bagolypillék (Noctuidae), mint gyapotbagolypille (*Spodoptera litura*), rizsbagolypille (*Pseudoleia separata*) és káposzta-bagolypille (*Mamestra brassi-*

cae), fehérlepkék (Pieridae), mint közönséges répalepke (*Pieris rapae crucivora*), sodrómolyok (Tortricidae), mint Adoxophyes spp., Carposinidae, ezüstszerű molyok (Lyoniidae), gyapjaslepkék (Lymntriidae), Anographa spp., Agrotis spp., mint vetési bagolypille (*Agrotis segetum*) és nagy fűbagolypille (*Agrotis ipsilon*), Helicoverpa spp., Heliothis spp., káposztamoly (*Plutella xylostella*), rizsmoly (*Parnara guttata*), szűcsmoly (*Tinea pellionella*), ruhamoly (*Tineola bisselliella*) és más hasonlóak,

kétszárnyúak: házi szúnyogok (*Culex* spp.), mint közönséges vagy dalosszúnyog (*Culex pipiens pallens*) és *Culex tritaeniorhynchus*, tócsaszúnyogok (*Aedes* spp.), mint sárgalázsszúnyog (*Aedes aegypti*) és *Aedes albopictus*, maláriaszúnyogok (*Anopheles* spp.), mint *Anopheles sinensis*, árvaszúnyogok (Chironomidae), legyek (Muscidae), mint házilegy (*Musca domestica*), kerítéslegy (*Muscina stabulans*), dongólegyek (Calliphoridae), húslegyek (Sarcophagidae), viráglegyek (Anthomyiidae), mint babszárrontólegy (*Delia platura*), kis házilegy (*Fannia canicularis*) és hagymalegy (*Delia antiqua*), gyümölcslegyek (Tephritidae), harmaallegyek, gyümölcsleghyfélek, muslicák (Drosophilidae), pilleszárnyúak (Psychodidae), cseszlék (Simuliidae), bögölyök (Tabanidae), szuronyoslegyek (Stomoxysidae), marószúnyogok és más hasonlóak,

bogarak: gabona-gyökérférgesek, mint Diabrotica virgifera és Diabrotica undecimpunctata howardi, galacsinhajók (Scarabaeidae), mint Anomala cuprea és szójabogár (Anomala rufocuprea), zsiszisek (Curculionidae), mint kukoricazsiszik (Sitophilus zeamais), rizsziszik (Lissorhoptrus oryophilus), gyapotbimbó-likasztó (Anthonomus grandis) és kínai babzsiszik (Callosobruchus chinensis), gyászbogarak (Tenebrionidae), mint lisztbogár (Tenebrio molitor) és kukoricabogár (Tribolium castaneum), levélbogarak vagy aranybogarak (Chrysomelidae), mint rizslevélbogár (Oulema oryzae), Phyllotreta striolata és töklelevélbogár (Aulacophora femoralis), álszúk vagy kopogóbogarak (Anobiidae), Epilachna spp., mint Henosepilachna vigintioctopunctata, falisztbogarak (Lyctidae), csuklyás szúk vagy csuklyásbogarak (Bostrychidae), valódi cincérek (Cerambycidae), kis partiholyva (Paederus fuscipes) és más hasonlóak,

petetokosok: német csótány (Blattella germanica), füstös barna csótány (Periplaneta fuliginosa), amerikai csótány (Periplaneta americana), barna csótány (Periplaneta brunnea), konyhai csótány (Blatta orientalis) és más hasonlóak,

tripszek: pálmatripsz (Thrips palmi), virágtripszek (Thrips hawaiiensis és Frankliniella occidentalis) és más hasonlóak,

hártyásszárnyúak: hangyák (Formicidae), valódi darazsak (Vespidae), bogároló darazsak (Bethyidae), valódi levéldarazsak (Tenthredinidae), mint repcelevéldarázs (Athalia rosae ruficornis) és más hasonlóak,

ugró egyenesszárnyúak: lőtűcsökök (Gryllotalpidae), sáskák (Acrididae) és más hasonlóak,

bolhák: kutyabolha (Ctenocephalides canis), macskabolha (Ctenocephalides felis), emberbolha (Pulex irritans) és más hasonlóak,

vérszívó tetvek: ruhatetű (*Pediculus humanus*), lapostetű (*Phthirus pubis*) és más hasonló,

termeszek: *Reticulitermes separatus*, *Coptotermes formosanus* és más hasonló,

atkák: poratkák (*Pyroglyphidae*), mint amerikai poratka (*Dermatophagoides farinae*) és poratka (*Dermatophagoides pteronyssinus*), készletatkák (*Acaridae*), mint gombaotka (*Tyrophagus putrescentiae* Schrank) és barnalábú raktáratka (*Aleuroglyphus ovatus* Troupeau), háziatkák (*Glycyphagidae*), mint lakásatkák (*Glycyphagus privatus* és *Glycyphagus domesticus*) és szilvaatka (*Glycyphagus destructor* Schrank), ragadozó atkák (*Cheyletidae*), mint *Cheyletus melaccensis* és *Cheyletus moorei*, fonalaslábú atkák (*Tarsonemidae*), Chortoglyphus, páncélosatkák (*Oribatei*), fonóatkák (*Tetranychidae*), mint közönséges takácsatka (*Tetranychus urticae*), *Tetranychus konzawai*, vörös citromtakácsatka (*Panonychus citri*) és gyümölcsfonóatka (*Panonychus ulmi*), valódi kullancsok (*Ixodidae*), mint *Haemaphysalis longicornis* és más hasonló.

A találmány szerinti vegyületek hatékonyak olyan rovarkártvével szemben is, amelyek ellenállnak az ismert rovar- és/vagy atkaellenes hatóanyagoknak.

A találmány szerinti kártevőellenes kompozíciók például a kártevők elpusztítására vagy elűzésére használhatók.

Amikor a találmány szerinti vegyületeket kártevőellenes kompozíciók hatóanyagaiként használjuk, a találmány szerinti vegyületeket általában különféle készítményekké alakítjuk. Így előállíthatunk a találmány szerinti vegyületekkel például olajos készítményt, emulgeálható koncentrátumot, nedvesíthető port, folyékony koncentrátumokat (például vizes szuszpenziós koncentrátumot vagy vizes emulziós koncentrátumot), granulátumot, port, aeroszolt, hevíthető füstölőszereket (például moszkítótekerceszt, elektromos moszkítólapot, oladatokat, amelyek abszorbens kanóccal működő termikus füstölőberendezésben használhatók), éghető füstölőszereket (például önégető füstölőszert, elektromos fűtésű füstölőszereket, amelyekben porózus kerámialapot alkalmaznak), fűtést nem igénylő párologtatós készítményeket (például gyantás vagy impregnált papiros párologtatós készítményeket), ködképzőket, ULV készítményeket, mérgező csalétket vagy más hasonlókat. Ezeket vagy úgy készítjük el, hogy a találmány szerinti vegyületeket összekeverjük a szilárd, folyékony vagy gázalakú vivőanyaggal vagy csalétkkel, vagy oly módon, hogy egy alap, például moszkítótekercesz vagy moszkítólap anyagát impregnáljuk a találmány szerinti vegyülettel, és adott esetben a készítményhez még felületaktív anyagot vagy más segédanyagokat adunk.

Ezek a készítmények a hatóanyagként használt találmány szerinti vegyületeket általában 0,001–95 tömeg% mennyiségben tartalmazzák.

A készítményekhez szilárd vivőanyagként használhatunk például agyagokat (például kaolinagyagot, diatomaföldet, szintetikus hidratált szilícium-dioxidot, bentonitot, fubasami agyagot vagy savas agyagot), talkumot, kerámiai anyagokat és más szervesen ásványi

anyagokat (például szericitet, kvarcot, aktív szenet, kalcium-karbonátot vagy hidratált szilícium-dioxidot), valamint műtrágyákat (például ammónium-szulfátot, ammónium-foszfátot, ammónium-nitrátot, karbamidot vagy ammónium-kloridot) finom por vagy granulátum alakjában. Folyékony vivőanyagként a készítmények tartalmazhatnak például vizet, alkoholokat (például metanolt vagy etanolt), ketonokat (például acetont vagy metil-etil-ketont), aromás szénhidrogéneket (például benzolt, toluolt, xilolt, etil-benzolt vagy metil-naftalint), alifás szénhidrogéneket (például hexánt, ciklohexánt, kerozint vagy könnyűolajat), észtereket (például etil-acetátot vagy butil-acetátot), nitrileket (például acetonitrilt vagy izobutironitrilt), étereket (például diizopropil-étert vagy dioxánt), savamidokat (például N,N-dimetil-formamidot vagy N,N-dimetilacetamidot), halogénezett szénhidrogéneket (például diklór-metánt, triklór-etánt vagy szén-tetrakloridot), dimetil-szulfoxidot, növényi olajokat (például szójababolajat vagy gyapotmagolajat). Gázalakú vivőanyagként, vagyis hajtóanyagként a készítmények tartalmazhatnak például CFC-gázt, butángázt, LPG-t (cseppfolyósított földgázt), dimetil-étert vagy szén-dioxidot.

Felületaktív anyagként tartalmazhatnak a találmány szerinti készítmények például alkil-szulfátokat, alkil-szulfonátokat, alkil-aril-szulfonátokat, alkil-aril-étereket és azok polioxi-etilénezett termékeit, polietilén-glikol-étereket, többfunkciós alkoholok észtereit vagy cukoralkoholszármazékokat.

A készítmények segédanyagaiként, például ragasztóanyagként és diszpergálóanyagként használhatunk például kazeint, zselatint, poliszacharidokat (például keményítőport, arabmégát, cellulózszármazékokat vagy alginátot), ligninszármazékokat, bentonitot, szacharidokat, szintetikus vízzoldható polimereket [például poli(vinil-alkohol)-okat, poli(vinil-pirrolidon)-okat, vagy poliakrilsavakat]. Stabilizátorként használhatunk PAP-t (savas izopropil-foszfát), BHT-t (2,6-di-terc-butil-4-metil-fenol), BHA-t (2-terc-butil-4-metoxi-fenol és 3-terc-butil-4-metoxi-fenol keveréke), növényi olajokat, ásványi olajokat, felületaktív anyagokat, valamint zsírsavakat és azok észtereit.

A mérgező csalétek alapanyagai például csalétek-komponensek (például gabonaliszt, növényi olajok, szacharidok vagy kristályos cellulóz), antioxidánsok (például dibutil-hidrox-toluol vagy nor-dihidro-gvajarétsav), tartósítószer (például dehidroecetsav), a gyermekeket és a diszállatokat távol tartó anyagok (például pirospaprikapor) és attraktánsok (például sajtaroma, hagymaaroma és földimogyoró-aroma).

A folyékony koncentrátumot (vizeszuszpenzió vagy vizesemulzió-koncentrátum) általában úgy készítjük el, hogy a találmány szerinti vegyület 1–75 tömeg% mennyiségét finoman diszpergáljuk vízben, amely 0,5–15 tömeg% diszpergálószer, 0,1–10 tömeg% szuszpendáló segédanyagot (például védőkolloidot vagy egy tixotróp sajátságokat kölcsönző vegyületet) és 0–10 tömeg% megfelelő segédanyagot (például habzásgátlót, rozsdásodásgátlót, stabilizálószer, szétoszlást elősegítő anyagot, behatolást elősegítő segédanyagot, fagyás-

gátlót, baktericidet vagy fungicidet) tartalmaz. Készíthetünk azonban olajalapú szuszpenziós koncentrátumot is, a víz helyett egy olajat használva, amelyben a találmány szerinti vegyület lényegében nem oldódik.

Védőkolloidként például zselatint, kazeint, gyantákat, cellulózétert vagy poli(vinil-alkohol)-okat használunk.

A tixotróp tulajdonságokat adó anyag lehet például bentonit, alumínium-magnézium-szilikát, xantángyanta vagy poliakrilsavak.

Az így kapott készítményeket vagy önmagukban vagy pedig vízzel vagy más hasonló anyaggal hígítva alkalmazzuk. Alkalmazhatjuk őket összekeverve vagy kombinálva más inszekticidekkel, akaricidekkel, nematocidokkal, talajban élő rovarkártévként elleni hatóanyagokkal, fungicidekkel, herbicidekkel, növénynövekedést szabályozó szerekkel, repellensekkel, szinergetikus hatást adó anyagokkal, műtrágyákkal vagy talajkondicionáló anyagokkal.

Ilyen inszekticid, nematocid, akaricid vagy talajban élő rovarkártévként elleni hatóanyagok lehetnek például foszfor-organikus vegyületek, mint fenitrothion [O,O-dimetil-O-(3-metil-4-nitro-fenil)foszforotioát], fention [O,O-dimetil-O-(3-metil-4-(metil-tio)-fenil)foszforotioát], diazinon [O,O-dietil-O-(2-izopropil-6-metil-pirimidin-4-il)foszforotioát], klórpírifosz [O,O-dietil-O-(3,5,6-triklór-2-piridil)foszforotioát], acefát [O,S-dimetil-acetil-foszforamidotioát], metidation [S-2,3-dihidro-5-metoxi-2-oxo-1,3,4-tiadiazol-3-il-metil-O,O-dimetil-foszforoditioát], disulfoton [O,O-dietil-S-2-(etil-tio)etil-foszforoditioát], diklórfosz [2,2-diklórvinil-dimetil-foszfat], szulprofosz [O-etil-O-4-(metil-tio)fenil-S-propil-foszforoditioát], cianofosz [O-4-ciano-fenil-O,O-dimetil-foszforotioát], dioxabenzofosz [2-metoxi-4H-1,3,2-benzodioxafoszforin-2-szulfid], dimetoát [O,O-dimetil-S-(N-metilkarbamoil-metil)ditiofoszfát], fentoát [etil-2-dimetoxi-foszfinio-tio-(fenil)acetát], malation [di-etil-(dimetoxifoszfinio-tio-tio)szukcinát], triklórfon [dimetil-2,2,2-triklór-1-hidroxi-etil-foszfonát], azinfoszmetil [S-3,4-dihidro-4-oxo-1,2,3-benzotriazin-3-il-metil-O,O-dimetil-foszforoditioát], monokrotofosz [dimetil-[(E)-1-metil-2-(metil-karbamoil)vinil]-foszfát], etion [O,O,O',O'-tetraetil-S,S'-metilén-bisz(foszforoditioát)] és más hasonló, karbamátvegyületek, mint például BPMC [2-(szek-butil)fenil-metil-karbamát], benfurakarb [etil-N-{2,3-dihidro-2,2-dimetil-benzofurán-7-il-oxi-karbonil-(metil)-amino-tio}-N-izopropil-β-alaninát], propoxur [2-izopropoxi-fenil-N-metil-karbamát], karboszulfán [2,3-dihidro-2,2-dimetil-7-benzo[b]furanil-N-dibutyl-amino-tio-N-metil-karbamát], karbaril [1-naftil-N-metilkarbamát], metomil [S-metil-N-(metil-karbamoil-oxi)tioacetimidát], etiofenkarb [2-(etil-tio-metil)fenil-metil-karbamát], aldikarb [2-metil-2-(metil-tio)propionaldehid-O-metil-karbamoiloxim], oxamil [N,N-dimetil-2-(metilkarbamoiloximino)-2-(metil-tio)-acetamid], fenotiokarb [S-4-fenoxi-butyl-N,N-dimetil-tiokarbamát] és más hasonló, piretroidvegyületek, mint például etofenprox [2-(4-etoxi-fenil)-2-metil-1-(3-fenoxi-benzil)oxipropán], fenvalerát [(RS)-α-ciano-3-fenoxi-benzil-(RS)-2-(4-klór-fenil)-3-metilbutirát], es-

fenvalerát [(S)-α-ciano-3-fenoxi-benzil-(S)-2-(4-klór-fenil)-3-metilbutirát], fenpropatrin [(RS)-α-ciano-3-fenoxi-benzil-2,2,3,3-tetrametil-ciklopropánkarboxilát], cipermetrin [(RS)-α-ciano-3-fenoxi-benzil-(1RS)-cisz,transz-3-(2,2-diklórvinil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát], permetrin [3-fenoxi-benzil-(1RS)-cisz,transz-3-(2,2-diklórvinil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát], cihalotrin [(RS)-α-ciano-3-fenoxi-benzil-(1RS,3Z)-cisz-3-(2-klór-3,3,3-trifluorprop-1-enil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát], deltametrin [(S)-α-ciano-3-fenoxi-benzil-(1R)-cisz-3-(2,2-dibromvinil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát], cikloprotrin [(RS)-α-ciano-3-fenoxi-benzil-(RS)-2,2-diklór-1-(4-etoxi-fenil)ciklopropánkarboxilát], fluvalinát [α-ciano-3-fenoxi-benzil-N-(2-klór α,α,α-trifluor-p-tolil)-D-valinát], bifentrin [2-metil-3-fenil-benzil-(1RS,3Z)-cisz-3-(2-klór-3,3,3-trifluor-1-propenil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát], halfenprox [2-[4-(brom-difluor-metoxi)fenil]-2-metil-1-(3-fenoxi-benzil)oxi-propán], tralometrin [(S)-α-ciano-3-fenoxi-benzil-(1R)-cisz-3-(1,2,2,2-tetrabrom-etil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát], szilafluofen [(4-etoxi-fenil)-{3-(4-fluor-3-fenoxi-fenil)propil} dimetil-szilán], d-fenotrin [3-fenoxi-benzil-(1R)-cisz,transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilát], cifenotrin [(RS)-α-ciano-3-fenoxi-benzil-(1R)-cisz,transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilát], d-rezmetrin [5-benzil-3-furilmetil-(1R)-cisz,transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilát], akrinatrin [(S)-α-ciano-3-fenoxi-benzil-(1R,3Z)-cisz-(2,2-dimetil-3-{3-oxo-3-(1,1,1,3,3,3-hexafluor-propil-oxi)-propenil}-ciklopropánkarboxilát], ciflutrin [(RS)-α-ciano-4-fluor-3-fenoxi-benzil-3-(2,2-diklórvinil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát], teflutrin [2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-benzil-(1RS,3Z)-cisz-3-(2-klór-3,3,3-trifluor-1-propenil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát], transzflutrin [2,3,5,6-tetrafluor-benzil-(1R)-transz-3-(2,2-diklórvinil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát], tetrametrin [3,4,5,6-tetrahidroftalimido-metil-(1RS)-cisz,transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilát], alletrin [(RS)-2-metil-4-oxo-3-(2-propenil)-2-ciklopenten-1-il-(1RS)-cisz,transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilát], pralletrin [(S)-2-metil-4-oxo-3-(2-propenil)-2-ciklopenten-1-il-(1R)-cisz,transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilát], empentrin [(RS)-1-etinil-2-metil-2-pentenil-(1R)-cisz,transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilát], imiprotrin [2,5-dioxo-3-(2-propenil)imidazolidin-1-il-metil-(1R)-cisz,transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilát], d-flametrin [5-(2-propenil)furfuril-(1R)-cisz,transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilát] 5-(2-propenil)-furfuril-2,2,3,3-tetrametil-ciklopropánkarboxilát és más hasonló, tiadiazinszármazékok, mint például buprofezin [2-(terc-butylimino)-3-izopropil-5-fenil-1,3,5-tiadiazin-4-on] és más hasonló, nitro-imidazolidin-származékok, mint imidakloprid [1-(6-klór-3-piridil-metil)-N-nitro-imidazolidin-2-ilidén-amin] és más hasonló, nereistoxinszármazékok, mint például kartap [S,S'-(2-dimetil-amino-trimetilén)-bisz(tiokarbamát)], [N,N-dimetil-1,2,3-tritian-5-

il-amin], [S,S'-2-dimetil-amino-trimetilén-di(benzoltio-szulfonát)] és más hasonló, N-ciano-amid-származékok, mint például N-ciano-N'-metil-N'-(6-klór-3-piridil-metil)acetamid és más hasonló, klórozott szénhidrogének, mint például endoszulfán [6,7,8,9,10,10-hexa-klór-1,5,5a,6,9,9a-hexahidro-6,9-metano-2,4,3-benzodioxatipin-3-oxid], γ -BHC [1,2,3,4,5,6-hexaklórciklohexán], dikofol [1,1-bisz(4-klór-fenil)-2,2,2-triklór-etanol] és más hasonló, benzoil-fenil-karbamid-származékok, mint például klórfluazuron [1-{3,5-diklór-4-(3-klór-5-(trifluor-metil)piridin-2-il-oxi)fenil}-3-(2,6-difluor-benzoil)karbamid], teflubenzuron [1-(3,5-diklór-2,4-difluor-fenil)-3-(2,6-difluor-benzoil)karbamid], flufenoxuron [1-{4-(2-klór-4-(trifluormetil)fenoxi)-2-fluor-fenil}-3-(2,6-difluor-benzoil)karbamid] és más hasonló, formamidinszármazékok, mint például amitraz [N,N'-{(metil-imino)dimetilidin}-di(2,4-xilidin)], klórdimeform [N'-(4-klór-2-metil-fenil)-N,N-dimetil-metimidamid] és más hasonló, tiokarbamid-származékok, mint például difentiuron [N-(2,6-diizopropil-4-fenoxi-fenil)-N'-terc-butilkarbamid] és más hasonló, N-fenilpirazol-származékok, metoxadiazon [5-metoxi-3-(2-metoxi-fenil)-1,3,4-oxadiazó-2-(3H)-on], bromopropilát [izopropil-4,4'-dibrómbenzilát], tetradifon [4-klór-fenil-2,4,5-triklór-fenil-szulfon], kinometionát [S,S-6-metilkinoxalin-2,3-diil-ditiokarbonát], propargit [2-(4-terc-butyl-fenoxi)ciklohexil-prop-2-il-szulfid], fenbutatin-oxid [bisz(trisz(2-metil-2-fenilpropil)ón)oxid], hexitiazox [(4RS,5RS)-5-(4-klór-fenil)-N-ciklohexil-4-metil-2-oxo-1,3-tiazolidin-3-karboxamid], [3,6-bisz(2-klór-fenil)-1,2,4,5-tetrazin], piridaben [2-terc-butyl-5-(4-terc-butyl-benzil-tio)-4-klór-piridazin-3(2H)-on], fenpiroximat [terc-butyl-(E)-4-{1,3-dimetil-5-fenoxipirazol-4-il}metilén-amino-oxi-metil]benzoát], tebufenpirad [N-4-terc-butyl-benzil)-4-klór-3-etil-1-metil-5-pirazol-karboxamid], poinaktinkomplexek [tetranaktin, dinaktin és trinaktin], pirimidifen [5-klór-N-[2-{4-(2-etoxi-etil)-2,3-dimetil-metoxi}etil]-6-etil-pirimidin-4-amin], milbemectin, abamectin, ivermectin, azadirachtin [AZAD] és más hasonló. A repellenes készítmények tartalmaznak például 3,4-karanediolt, N,N-dietyl-m-toluamidot, 1-metil-propil-2-(2-hidroxi-etil)-1-piperidinkarboxilátot, *p*-mentán-3,8-diolt, valamint esszenciális növényi olajokat, mint például izsópolajat. Aktivátor hatású vegyületek lehetnek például bisz(2,3,3,3-tetraklór-propil)-éter-(S-421), N-(2-etil-hexil)-biciklo-[2.2.1]hept-5-én-2,3-dikarboximid (MGK-264), valamint α -[2-(2-butox-metoxi)etoxi]-4,5-(metilén-dioxi)-2-propil-toluol (piperonil-butoxid).

Amikor a találmány szerinti vegyületeket kártevőellenes kompozíciók hatóanyagaiként használjuk, általában 5–500 g/10 ár dózisban alkalmazzuk. Ha emulgeálható koncentrátum, nedvesíthető por vagy folyékony koncentrátum alakjában használjuk, akkor felhasználás előtt vízzel felhígítjuk annyira, hogy a készítményben a találmány szerinti vegyület koncentrációja 0,1–1000 ppm között legyen. Amikor a találmány szerinti vegyületeket granulátumok, porok vagy gyantakészítmények alakjában használjuk, akkor ezeket a készítményeket hígítás nélkül alkalmazzuk. Ha a találmány szerinti vegyülete-

ket lakóhelyi járvány megakadályozására készített vagy állatokon élősködő kártevők elleni kompozíciók hatóanyagaiként használjuk, és emulgeálható koncentrátum, nedvesíthető por vagy folyékony koncentrátum alakjában alkalmazzuk, akkor ezeket a készítményeket vízzel 0,1–10 000 ppm hatóanyag-koncentrációra felhígítjuk felhasználás előtt. Az olajos készítményeket, az aeroszolókat, a füstölőszereket, az égethető füstölőszereket, az elpárolgatható kompozíciókat, a ködképzőket, az ULV kompozíciókat, a mérgező csalétketeket vagy a gyantakészítményeket eredeti alakjukban alkalmazzuk.

A felsorolt készítményeknek mind a dózisa, mind a felhasználási koncentrációja megfelelően meghatározható a körülményektől függően, nevezetesen a készítmény típusának, alkalmazási idejének, helyének és módjának, valamint a kártevő sajátosságainak, a kár mértékének és más körülményeknek a figyelembevételével, és növelhető vagy csökkenthető a fenti intervallumhatároktól függetlenül is.

A találmányt a következő előállítási példákkal, készítménypéldákkal és kísérleti példákkal szemléltetjük, melyekkel azonban nem szándékozzuk korlátozni a találmány oltalmi körét.

Először a találmány szerinti vegyületek előállítását mutatjuk be példákban és az 1–16. táblázatokban, amelyekben feltüntetjük a találmány szerinti vegyületek referenciaszámát.

1. előállítási példa

1,78 g (2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)metanol, 0,87 g piridin és 20 ml tetrahydrofuran keverékéhez jegeshűtés közben hozzáadunk 2,06 g (1R)-transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarbonsav-kloridot. A kapott reakcióelegyet 8 órán át keverjük szobahőmérsékleten. A reakcióelegyet ezután mintegy 100 ml jeges vízbe öntjük, és kétszer 100 ml etil-acetáttal extraháljuk. Az egyesített etil-acetátos fázisokat telített vizes konyhasóoldattal mossuk, vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk, és csökkentett nyomáson bepároljuk. A maradékot szilikagéllal töltött oszlopon kromatografálva tisztítjuk, eluálószerként 20:1 térfogatarányú hexán/etil-acetát elegyet használunk. 2,75 g (87%) (2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)metil-(1R)-transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilátot kapunk. 1,27 g (2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)metil-(1R)-transz-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciklopropánkarboxilát, 20 ml metanol és 20 ml etil-acetát keverékét –78 °C-ra hűtjük le. A reakcióelegyen oxigént tartalmazó ózont buborékoltatunk át, és addig keverjük a reakcióelegyet, míg az kékre nem színeződik. Ekkor nitrogént buborékoltatunk át rajta, hogy eltávolítsuk az ózonfőlöslegét. Ezután 5 ml dimetil-szulfidot adunk a reakcióelegyhez és szobahőmérsékleten melegítjük fel. A reakcióelegyet állni hagyjuk egy napig, azután csökkentett nyomáson betöményítjük. A kapott maradékhoz 20 ml acetont, 2 ml vizet és 0,2 g *p*-toluolszulfonsav-monohidrárt adunk. A kapott reakcióelegyet állni hagyjuk szobahőmérsékleten 2 óra hosszat, azután vízbe öntjük és dietil-éterrel extraháljuk. A szerves fázist vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk és csökkentett nyo-

máson bepároljuk. A kapott maradékot szilikagéllal töltött oszlopon kromatografálva tisztítjuk, eluálószerként 10:1 térfogatarányú hexán-etil-acetát elegyet használunk. 0,98 g (82%) (2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)metil-(1R)-transz-3-formil-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilátot kapunk, amely 43,2 °C-on olvad.

0,32 g O-metil-hidroxil-amin-hidroklorid, 0,16 g nátrium-hidroxid és 10 ml metanol keverékét 1 órán át keverjük. Keverés közben hozzáadjuk 0,56 g (2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)metil-(1R)-transz-3-formil-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát 3 ml metanollal készített oldatát. 12 óra keverés után a reakcióelegyhez vizet adunk, és a reakcióelegyet dietil-éterrel extraháljuk. A szerves fázist nátrium-szulfáton megszáritjuk, és csökkentett nyomáson bepároljuk. A kapott maradékot szilikagéllal töltött oszlopon kromatografálva tisztítjuk, eluálószerként 10:1 térfogatarányú hexán/etil-acetát elegyet használva. 0,28 g (46%) (2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)metil-(1R)-transz-3-[(E)-metoxi-imino-metil]-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilátot (11. vegyület) kapunk. A kromatografálást tovább folytatjuk 4:1 térfogatarányú hexán/etil-acetát elegy eluálószerrel, amikor is 0,23 g (38%) (2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)metil-(1R)-transz-3-[(Z)-metoxi-imino-metil]-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilátot (36. vegyület) kapunk.

2. előállítási példa

Diizopropil-azodikarboxilát toluollal készített 40 tömeg%-os oldatának 2,4 g-ját keverés közben hozzáadjuk egy keverékhez, amely (1R)-transz-3-[(E)-metoxi-imino]-2,2-dimetil-ciklopropánkarbonsav és (1R)-transz-3-[(Z)-metoxi-imino]-2,2-dimetil-ciklopropánkarbonsav 1:1 molarányú keverékének 0,63 g-ját tartalmazza 0,78 g (2,3,5,6-tetrafluor-fenil)metanol, 1,16 g trifenil-foszfín és 15 ml tetrahidrofuran mellett. A reakcióelegyet egy napig állni hagyjuk, azután csökkentett nyomáson betöményítjük. A kapott maradékot szilikagéllal töltött oszlopon kromatografáljuk 3:1 térfogatarányú hexán/etil-acetát eluálószerrel. A kapott frakciót újra kromatografáljuk szilikagéllal töltött oszlopon, eluálószerként ezúttal 10:1 térfogatarányú hexán/etil-acetát elegyet használva. 0,53 g (42%) (2,3,5,6-tetrafluor-fenil)metil-(1R)-transz-3-[(E)-metoxi-imino-metil]-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilátot (9. vegyület), majd azt követően 0,47 g (37%) (2,3,5,6-tetrafluor-fenil)metil-(1R)-transz-3-[(Z)-metoxi-imino-metil]-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilátot (34. vegyület) kapunk.

3. előállítási példa

(1R)-cisz-3-[(E)-metoxi-imino]-2,2-dimetil-ciklopropánkarbonsav és (1R)-cisz-3-[(Z)-metoxi-imino]-2,2-dimetil-ciklopropánkarbonsav 1:1 molarányú keverékének 0,81 g-ját összekeverjük 1,01 g 1-(klór-metil)-2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-benzollal, 1,1 g trietil-aminnal és 15 ml N,N-dimetilformamiddal. A kapott reakcióelegyet 3 órán át keverjük 80 °C hőmérsékleten, majd szobahőmérsékletre hűtjük le, vizet adunk hozzá és terc-butil-metil-éterrel extraháljuk. A szerves fázist nátrium-szulfáton megszáritjuk, azután csökkentett nyomáson bepároljuk. A kapott maradékot szilikagéllal töltött

oszlopon kromatografáljuk, eluálószerként 10:1 térfogatarányú hexán/etil-acetát elegyet használva. (2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)metil-(1R)-cisz-3-[(E)-metoxi-imino-metil]-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát (61. vegyület) és 2,3,5,6-tetrafluor-4-metil-fenil)metil-(1R)-cisz-3-[(Z)-metoxi-imino-metil]-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát (86. vegyület) 1:1 molarányú keverékét kapjuk 82% hozammal.

A (2) általános képletű találmány szerinti vegyületek további példáit a következő 1–16. táblázatokban mutatjuk be, anélkül azonban, hogy a találmány oltalmi körét ezekre korlátoznánk.

1. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
1	H	H	1R-transz-E
2	H	F	1R-transz-E
3	H	Me	1R-transz-E
4	H	allil	1R-transz-E
5	H	propargil	1R-transz-E
6	H	MeOCH ₂	1R-transz-E
7	H	MeO	1R-transz-E
8	H	MeS	1R-transz-E
9	Me	H	1R-transz-E
10	Me	F	1R-transz-E
11	Me	Me	1R-transz-E
12	Me	allil	1R-transz-E
13	Me	propargil	1R-transz-E
14	Me	MeOCH ₂	1R-transz-E
15	Me	MeO	1R-transz-E
16	Me	MeS	1R-transz-E
17	Et	H	1R-transz-E
18	Et	Me	1R-transz-E
19	Pr	H	1R-transz-E
20	Pr	Me	1R-transz-E
21	i-Pr	H	1R-transz-E
22	i-Pr	Me	1R-transz-E
23	CF ₃ CH ₂	Me	1R-transz-E
24	allil	Me	1R-transz-E
25	propargil	Me	1R-transz-E

2. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
26	H	H	1R-transz-Z
27	H	F	1R-transz-Z
28	H	Me	1R-transz-Z

2. táblázat (folytatás)

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
29	H	allil	1R-transz-Z
30	H	propargil	1R-transz-Z
31	H	MeOCH ₂	1R-transz-Z
32	H	MeO	1R-transz-Z
33	H	MeS	1R-transz-Z
34	Me	H	1R-transz-Z
35	Me	F	1R-transz-Z
36	Me	Me	1R-transz-Z
37	Me	allil	1R-transz-Z
38	Me	propargil	1R-transz-Z
39	Me	MeOCH ₂	1R-transz-Z
40	Me	MeO	1R-transz-Z
41	Me	MeS	1R-transz-Z
42	Et	H	1R-transz-Z
43	Et	Me	1R-transz-Z
44	Pr	H	1R-transz-Z
45	Pr	Me	1R-transz-Z
46	i-Pr	H	1R-transz-Z
47	i-Pr	Me	1R-transz-Z
48	CF ₃ CH ₂	Me	1R-transz-Z
49	allil	Me	1R-transz-Z
50	propargil	Me	1R-transz-Z

3. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
51	H	H	1R-cisz-E
52	H	F	1R-cisz-E
53	H	Me	1R-cisz-E
54	H	allil	1R-cisz-E
55	H	propargil	1R-cisz-E
56	H	MeOCH ₂	1R-cisz-E
57	H	MeO	1R-cisz-E
58	H	MeS	1R-cisz-E
59	Me	H	1R-cisz-E
60	Me	F	1R-cisz-E
61	Me	Me	1R-cisz-E
62	Me	allil	1R-cisz-E
63	Me	propargil	1R-cisz-E
64	Me	MeOCH ₂	1R-cisz-E

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
65	Me	MeO	1R-cisz-E
66	Me	MeS	1R-cisz-E
67	Et	H	1R-cisz-E
68	Et	Me	1R-cisz-E
69	Pr	H	1R-cisz-E
70	Pr	Me	1R-cisz-E
71	i-Pr	H	1R-cisz-E
72	i-Pr	Me	1R-cisz-E
73	CF ₃ CH ₂	Me	1R-cisz-E
74	allil	Me	1R-cisz-E
75	propargil	Me	1R-cisz-E

4. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
76	H	H	1R-cisz-Z
77	H	F	1R-cisz-Z
78	H	Me	1R-cisz-Z
79	H	allil	1R-cisz-Z
80	H	propargil	1R-cisz-Z
81	H	MeOCH ₂	1R-cisz-Z
82	H	MeO	1R-cisz-Z
83	H	MeS	1R-cisz-Z
84	Me	H	1R-cisz-Z
85	Me	F	1R-cisz-Z
86	Me	Me	1R-cisz-Z
87	Me	allil	1R-cisz-Z
88	Me	propargil	1R-cisz-Z
89	Me	MeOCH ₂	1R-cisz-Z
90	Me	MeO	1R-cisz-Z
91	Me	MeS	1R-cisz-Z
92	Et	H	1R-cisz-Z
93	Et	Me	1R-cisz-Z
94	Pr	H	1R-cisz-Z
95	Pr	Me	1R-cisz-Z
96	i-Pr	H	1R-cisz-Z
97	i-Pr	Me	1R-cisz-Z
98	CF ₃ CH ₂	Me	1R-cisz-Z
99	allil	Me	1R-cisz-Z
100	propargil	Me	1R-cisz-Z

5. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
101	H	H	1RS-transz-E
102	H	F	1RS-transz-E
103	H	Me	1RS-transz-E
104	H	allil	1RS-transz-E
105	H	propargil	1RS-transz-E
106	H	MeOCH ₂	1RS-transz-E
107	H	MeO	1RS-transz-E
108	H	MeS	1RS-transz-E
109	Me	H	1RS-transz-E
110	Me	F	1RS-transz-E
111	Me	Me	1RS-transz-E
112	Me	allil	1RS-transz-E
113	Me	propargil	1RS-transz-E
114	Me	MeOCH ₂	1RS-transz-E
115	Me	MeO	1RS-transz-E
116	Me	MeS	1RS-transz-E
117	Et	H	1RS-transz-E
118	Et	Me	1RS-transz-E
119	Pr	H	1RS-transz-E
120	Pr	Me	1RS-transz-E
121	i-Pr	H	1RS-transz-E
122	i-Pr	Me	1RS-transz-E
123	CF ₃ CH ₂	Me	1RS-transz-E
124	allil	Me	1RS-transz-E
125	propargil	Me	1RS-transz-E

6. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
126	H	H	1RS-transz-Z
127	H	F	1RS-transz-Z
128	H	Me	1RS-transz-Z
129	H	allil	1RS-transz-Z
130	H	propargil	1RS-transz-Z
131	H	MeOCH ₂	1RS-transz-Z
132	H	MeO	1RS-transz-Z
133	H	MeS	1RS-transz-Z
134	Me	H	1RS-transz-Z
135	Me	F	1RS-transz-Z
136	Me	Me	1RS-transz-Z
137	Me	allil	1RS-transz-Z

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
138	Me	propargil	1RS-transz-Z
139	Me	MeOCH ₂	1RS-transz-Z
140	Me	MeO	1RS-transz-Z
141	Me	MeS	1RS-transz-Z
142	Et	H	1RS-transz-Z
143	Et	Me	1RS-transz-Z
144	Pr	H	1RS-transz-Z
145	Pr	Me	1RS-transz-Z
146	i-Pr	H	1RS-transz-Z
147	i-Pr	Me	1RS-transz-Z
148	CF ₃ CH ₂	Me	1RS-transz-Z
149	allil	Me	1RS-transz-Z
150	propargil	Me	1RS-transz-Z

7. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
151	H	H	1RS-cisz-E
152	H	F	1RS-cisz-E
153	H	Me	1RS-cisz-E
154	H	allil	1RS-cisz-E
155	H	propargil	1RS-cisz-E
156	H	MeOCH ₂	1RS-cisz-E
157	H	MeO	1RS-cisz-E
158	H	MeS	1RS-cisz-E
159	Me	H	1RS-cisz-E
160	Me	F	1RS-cisz-E
161	Me	Me	1RS-cisz-E
162	Me	allil	1RS-cisz-E
163	Me	propargil	1RS-cisz-E
164	Me	MeOCH ₂	1RS-cisz-E
165	Me	MeO	1RS-cisz-E
166	Me	MeS	1RS-cisz-E
167	Et	H	1RS-cisz-E
168	Et	Me	1RS-cisz-E
169	Pr	H	1RS-cisz-E
170	Pr	Me	1RS-cisz-E
171	i-Pr	H	1RS-cisz-E
172	i-Pr	Me	1RS-cisz-E
173	CF ₃ CH ₂	Me	1RS-cisz-E
174	allil	Me	1RS-cisz-E
175	propargil	Me	1RS-cisz-E

8. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
176	H	H	1RS-cisz-Z
177	H	F	1RS-cisz-Z
178	H	Me	1RS-cisz-Z
179	H	allil	1RS-cisz-Z
180	H	propargil	1RS-cisz-Z
181	H	MeOCH ₂	1RS-cisz-Z
182	H	MeO	1RS-cisz-Z
183	H	MeS	1RS-cisz-Z
184	Me	H	1RS-cisz-Z
185	Me	F	1RS-cisz-Z
186	Me	Me	1RS-cisz-Z
187	Me	allil	1RS-cisz-Z
188	Me	propargil	1RS-cisz-Z
189	Me	MeOCH ₂	1RS-cisz-Z
190	Me	MeO	1RS-cisz-Z
191	Me	MeS	1RS-cisz-Z
192	Et	H	1RS-cisz-Z
193	Et	Me	1RS-cisz-Z
194	Pr	H	1RS-cisz-Z
195	Pr	Me	1RS-cisz-Z
196	i-Pr	H	1RS-cisz-Z
197	i-Pr	Me	1RS-cisz-Z
198	CF ₃ CH ₂	Me	1RS-cisz-Z
199	allil	Me	1RS-cisz-Z
200	propargil	Me	1RS-cisz-Z

9. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
201	Et	MeO	1R-transz-E
202	Et	allil	1R-transz-E
203	Et	propargil	1R-transz-E
204	Et	MeOCH ₂	1R-transz-E
205	Pr	MeO	1R-transz-E
206	Pr	allil	1R-transz-E
207	Pr	propargil	1R-transz-E
208	Pr	MeOCH ₂	1R-transz-E
209	i-Pr	MeO	1R-transz-E
210	i-Pr	allil	1R-transz-E
211	i-Pr	propargil	1R-transz-E
212	i-Pr	MeOCH ₂	1R-transz-E
213	CF ₃ CH ₂	H	1R-transz-E

5

10

15

20

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
214	CF ₃ CH ₂	MeO	1R-transz-E
215	CF ₃ CH ₂	allil	1R-transz-E
216	CF ₃ CH ₂	propargil	1R-transz-E
217	CF ₃ CH ₂	MeOCH ₂	1R-transz-E
218	allil	H	1R-transz-E
219	allil	MeO	1R-transz-E
220	H	Cl	1R-transz-E
221	Me	Cl	1R-transz-E
222	Et	Cl	1R-transz-E
223	H	CF ₃	1R-transz-E
224	Me	CF ₃	1R-transz-E
225	Et	CF ₃	1R-transz-E

10. táblázat

25

30

35

40

45

50

55

60

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
226	Et	MeO	1R-transz-Z
227	Et	allil	1R-transz-Z
228	Et	propargil	1R-transz-Z
229	Et	MeOCH ₂	1R-transz-Z
230	Pr	MeO	1R-transz-Z
231	Pr	allil	1R-transz-Z
232	Pr	propargil	1R-transz-Z
233	Pr	MeOCH ₂	1R-transz-Z
234	i-Pr	MeO	1R-transz-Z
235	i-Pr	allil	1R-transz-Z
236	i-Pr	propargil	1R-transz-Z
237	i-Pr	MeOCH ₂	1R-transz-Z
238	CF ₃ CH ₂	H	1R-transz-Z
239	CF ₃ CH ₂	MeO	1R-transz-Z
240	CF ₃ CH ₂	allil	1R-transz-Z
241	CF ₃ CH ₂	propargil	1R-transz-Z
242	CF ₃ CH ₂	MeOCH ₂	1R-transz-Z
243	allil	H	1R-transz-Z
244	allil	MeO	1R-transz-Z
245	H	Cl	1R-transz-Z
246	Me	Cl	1R-transz-Z
247	Et	Cl	1R-transz-Z
248	H	CF ₃	1R-transz-Z
249	Me	CF ₃	1R-transz-Z
250	Et	CF ₃	1R-transz-Z

11. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
251	Et	MeO	1R-cisz-E
252	Et	allil	1R-cisz-E
253	Et	propargil	1R-cisz-E
254	Et	MeOCH ₂	1R-cisz-E
255	Pr	MeO	1R-cisz-E
256	Pr	allil	1R-cisz-E
257	Pr	propargil	1R-cisz-E
258	Pr	MeOCH ₂	1R-cisz-E
259	i-Pr	MeO	1R-cisz-E
260	i-Pr	allil	1R-cisz-E
261	i-Pr	propargil	1R-cisz-E
262	i-Pr	MeOCH ₂	1R-cisz-E
263	CF ₃ CH ₂	H	1R-cisz-E
264	CF ₃ CH ₂	MeO	1R-cisz-E
265	CF ₃ CH ₂	allil	1R-cisz-E
266	CF ₃ CH ₂	propargil	1R-cisz-E
267	CF ₃ CH ₂	MeOCH ₂	1R-cisz-E
268	allil	H	1R-cisz-E
269	allil	MeO	1R-cisz-E
270	H	Cl	1R-cisz-E
271	Me	Cl	1R-cisz-E
272	Et	Cl	1R-cisz-E
273	H	CF ₃	1R-cisz-E
274	Me	CF ₃	1R-cisz-E
275	Et	CF ₃	1R-cisz-E

12. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
276	Et	MeO	1R-cisz-Z
277	Et	allil	1R-cisz-Z
278	Et	propargil	1R-cisz-Z
279	Et	MeOCH ₂	1R-cisz-Z
280	Pr	MeO	1R-cisz-Z
281	Pr	allil	1R-cisz-Z
282	Pr	propargil	1R-cisz-Z
283	Pr	MeOCH ₂	1R-cisz-Z
284	i-Pr	MeO	1R-cisz-Z
285	i-Pr	allil	1R-cisz-Z
286	i-Pr	propargil	1R-cisz-Z
287	i-Pr	MeOCH ₂	1R-cisz-Z

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
288	CF ₃ CH ₂	H	1R-cisz-Z
289	CF ₃ CH ₂	MeO	1R-cisz-Z
290	CF ₃ CH ₂	allil	1R-cisz-Z
291	CF ₃ CH ₂	propargil	1R-cisz-Z
292	CF ₃ CH ₂	MeOCH ₂	1R-cisz-Z
293	allil	H	1R-cisz-Z
294	allil	MeO	1R-cisz-Z
295	H	Cl	1R-cisz-Z
296	Me	Cl	1R-cisz-Z
297	Et	Cl	1R-cisz-Z
298	H	CF ₃	1R-cisz-Z
299	Me	CF ₃	1R-cisz-Z
300	Et	CF ₃	1R-cisz-Z

13. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
301	Et	MeO	1RS-transz-E
302	Et	allil	1RS-transz-E
303	Et	propargil	1RS-transz-E
304	Et	MeOCH ₂	1RS-transz-E
305	Pr	MeO	1RS-transz-E
306	Pr	allil	1RS-transz-E
307	Pr	propargil	1RS-transz-E
308	Pr	MeOCH ₂	1RS-transz-E
309	i-Pr	MeO	1RS-transz-E
310	i-Pr	allil	1RS-transz-E
311	i-Pr	propargil	1RS-transz-E
312	i-Pr	MeOCH ₂	1RS-transz-E
313	CF ₃ CH ₂	H	1RS-transz-E
314	CH ₃ CH ₂	MeO	1RS-transz-E
315	CF ₃ CH ₂	allil	1RS-transz-E
316	CF ₃ CH ₂	propargil	1RS-transz-E
317	CF ₃ CH ₂	MeOCH ₂	1RS-transz-E
318	allil	H	1RS-transz-E
319	allil	MeO	1RS-transz-E
320	H	Cl	1RS-transz-E
321	Me	Cl	1RS-transz-E
322	Et	Cl	1RS-transz-E
323	H	CF ₃	1RS-transz-E
324	Me	CF ₃	1RS-transz-E
325	Et	CF ₃	1RS-transz-E

14. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
326	Et	MeO	1RS-transz-Z
327	Et	allil	1RS-transz-Z
328	Et	propargil	1RS-transz-Z
329	Et	MeOCH ₂	1RS-transz-Z
330	Pr	MeO	1RS-transz-Z
331	Pr	allil	1RS-transz-Z
332	Pr	propargil	1RS-transz-Z
333	Pr	MeOCH ₂	1RS-transz-Z
334	i-Pr	MeO	1RS-transz-Z
335	i-Pr	allil	1RS-transz-Z
336	i-Pr	propargil	1RS-transz-Z
337	i-Pr	MeOCH ₂	1RS-transz-Z
338	CF ₃ CH ₂	H	1RS-transz-Z
339	CF ₃ CH ₂	MeO	1RS-transz-Z
340	CF ₃ CH ₂	allil	1RS-transz-Z
341	CF ₃ CH ₂	propargil	1RS-transz-Z
342	CF ₃ CH ₂	MeOCH ₂	1RS-transz-Z
343	allil	H	1RS-transz-Z
344	allil	MeO	1RS-transz-Z
345	H	Cl	1RS-transz-Z
346	Me	Cl	1RS-transz-Z
347	Et	Cl	1RS-transz-Z
348	H	CF ₃	1RS-transz-Z
349	Me	CF ₃	1RS-transz-Z
350	Et	CF ₃	1RS-transz-Z

15. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
351	Et	MeO	1RS-cisz-E
352	Et	allil	1RS-cisz-E
353	Et	propargil	1RS-cisz-E
354	Et	MeOCH ₂	1RS-cisz-E
355	Pr	MeO	1RS-cisz-E
356	Pr	allil	1RS-cisz-E
357	Pr	propargil	1RS-cisz-E
358	Pr	MeOCH ₂	1RS-cisz-E
359	i-Pr	MeO	1RS-cisz-E
360	i-Pr	allil	1RS-cisz-E
361	i-Pr	propargil	1RS-cisz-E
362	i-Pr	MeOCH ₂	1RS-cisz-E

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
363	CF ₃ CH ₂	H	1RS-cisz-E
364	CF ₃ CH ₂	MeO	1RS-cisz-E
365	CF ₃ CH ₂	allil	1RS-cisz-E
366	CF ₃ CH ₂	propargil	1RS-cisz-E
367	CF ₃ CH ₂	MeOCH ₂	1RS-cisz-E
368	allil	H	1RS-cisz-E
369	allil	MeO	1RS-cisz-E
370	H	Cl	1RS-cisz-E
371	Me	Cl	1RS-cisz-E
372	Et	Cl	1RS-cisz-E
373	H	CF ₃	1RS-cisz-E
374	Me	CF ₃	1RS-cisz-E
375	Et	CF ₃	1RS-cisz-E

16. táblázat

A vegyület száma	R	X	A savkomponens konfigurációja
376	Et	MeO	1RS-cisz-Z
377	Et	allil	1RS-cisz-Z
378	Et	propargil	1RS-cisz-Z
379	Et	MeOCH ₂	1RS-cisz-Z
380	Pr	MeO	1RS-cisz-Z
381	Pr	allil	1RS-cisz-Z
382	Pr	propargil	1RS-cisz-Z
383	Pr	MeOCH ₂	1RS-cisz-Z
384	i-Pr	MeO	1RS-cisz-Z
385	i-Pr	allil	1RS-cisz-Z
386	i-Pr	propargil	1RS-cisz-Z
387	i-Pr	MeOCH ₂	1RS-cisz-Z
388	CF ₃ CH ₂	H	1RS-cisz-Z
389	CF ₃ CH ₂	MeO	1RS-cisz-Z
390	CF ₃ CH ₂	allil	1RS-cisz-Z
391	CF ₃ CH ₂	propargil	1RS-cisz-Z
392	CF ₃ CH ₂	MeOCH ₂	1RS-cisz-Z
393	allil	H	1RS-cisz-Z
394	allil	MeO	1RS-cisz-Z
395	H	Cl	1RS-cisz-Z
396	Me	Cl	1RS-cisz-Z
397	Et	Cl	1RS-cisz-Z
398	H	CF ₃	1RS-cisz-Z
399	Me	CF ₃	1RS-cisz-Z
400	Et	CF ₃	1RS-cisz-Z

A találmány szerinti vegyületek fizikai jellemzőit az alábbiakban ismertetjük.

9. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,21 (3H, s), 1,29 (3H, s), 1,88 (1H, d, $J=5,4$), 2,21 (1H, dd, $J=7,2$, 5,4), 3,83 (3H, s), 5,24 (2H, br s), 7,10 (1H, tt, $J=9,7$, 7,4), 7,19 (1H, d, $J=7,2$)

10. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,21 (3H, s), 1,29 (3H, s), 1,87 (1H, d, $J=5,4$), 2,21 (1H, dd, $J=7,5$, 5,4), 3,83 (3H, s), 5,21 (2H, s), 7,19 (1H, d, $J=7,5$)

11. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,20 (3H, s), 1,29 (3H, s), 1,87 (1H, d, $J=5,5$), 2,21 (1H, dd, $J=7,5$, 5,5), 2,29 (3H, t, $J=2,1$), 3,83 (3H, s), 5,21 (2H, br s), 7,18 (1H, d, $J=7,5$)

15. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,20 (3H, s), 1,29 (3H, s), 1,86 (1H, d, $J=5,5$), 2,21 (1H, dd, $J=7,4$, 5,5), 3,83 (3H, s), 4,10 (3H, t, $J=1,5$), 5,18 (1H, t, $J=1,4$), 5,19 (1H, t, $J=1,4$), 7,19 (1H, d, $J=7,4$)

34. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,23 (3H, s), 1,30 (3H, s), 1,76 (1H, d, $J=5,5$), 2,70 (1H, dd, $J=7,8$, 5,5), 3,89 (3H, s), 5,25 (2H, br s), 6,31 (1H, d, $J=7,8$), 7,10 (1H, t, $J=9,7$, 7,4)

35.sz. vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,23 (3H, s), 1,29 (3H, s), 1,74 (1H, d, $J=5,5$), 2,69 (1H, dd, $J=7,9$, 5,5), 3,89 (3H, s), 5,22 (2H, br s), 6,31 (1H, d, $J=7,9$)

36. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,23 (3H, s), 1,30 (3H, s), 1,76 (1H, d, $J=5,6$), 2,29 (2H, t, $J=2,1$), 2,69 (1H, dd, $J=7,8$, 5,6), 3,89 (3H, s), 5,23 (2H, br s), 6,31 (1H, d, $J=7,8$)

40. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,23 (3H, s), 1,30 (3H, s), 1,75 (1H, d, $J=5,5$), 2,70 (1H, dd, $J=7,9$, 5,5), 3,89 (3H, s), 4,10 (3H, t, $J=1,5$), 5,19 (1H, t, $J=1,5$), 5,20 (1H, t, $J=1,5$), 6,31 (1H, d, $J=7,9$)

A 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,23 (1,5H, s), 1,24 (1,5H, s), 1,32 (3H, s), 1,85 (0,5H, s), 1,88 (0,5H, s), 2,00 (0,5H, t, $J=8,7$), 2,29 (3H, t, $J=2,1$), 2,47 (0,5H, dd, $J=8,7$, 7,9), 3,84 (1,5H, s), 3,89 (1,5H, s), 5,20 (2H, br s), 6,99 (0,5H, d, $J=7,9$), 7,69 (0,5H, d, $J=8,7$)

3. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,21 (3H, s), 1,30 (3H, s), 1,87 (1H, d, $J=5,5$), 2,21 (1H, dd, $J=7,1$, 5,5), 2,29 (3H, t, $J=2,1$), 5,22 (2H, s), 6,99 (1H, s), 7,26 (1H, d, $J=7,1$)

20. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 0,92 (3H, t, $J=7,6$), 1,20 (3H, s), 1,29 (3H, s), 1,65 (2H, qt, $J=7,6$, 6,8), 1,86 (1H, d, $J=5,5$), 2,21 (1H, dd, $J=7,4$, 5,5), 2,29 (3H, t, $J=2,0$), 3,97 (2H, t, $J=6,9$), 5,21 (2H, br s), 7,20 (1H, d, $J=7,4$)

24. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,20 (3H, s), 1,29 (3H, s), 1,87 (1H, d, $J=5,4$), 2,20 (1H, dd, $J=7,3$, 5,4), 2,29

(3H, t, $J=2,1$), 4,53 (2H, dt, $J=5,8$, 1,4), 5,21 (2H, br s), 5,22 (1H, dd, $J=10,4$, 1,6), 5,29 (1H, dd, $J=17,1$, 1,6), 5,97 (1H, ddt, $J=17,1$, 10,4, 5,8), 7,24 (1H, d, $J=7,3$)

28. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,24 (3H, s), 1,32 (3H, s), 1,77 (1H, d, $J=5,7$), 2,29 (3H, t, $J=2,2$), 2,76 (1H, dd, $J=7,7$, 5,7), 5,23 (2H, s), 6,41 (1H, d, $J=7,7$), 7,33 (1H, s)

49. számú vegyület

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,22 (3H, s), 1,30 (3H, s), 1,75 (1H, d, $J=5,5$), 2,29 (3H, t, $J=2,1$), 2,73 (1H, dd, $J=7,8$, 5,5), 4,59 (2H, br d, $J=5,7$), 5,21 (1H, dd, $J=10,4$, 1,5), 5,23 (2H, br s), 5,29 (1H, dd, $J=17,3$, 1,5), 5,99 (1H, ddt, $J=17,3$, 10,4, 5,7), 6,35 (1H, d, $J=7,8$)

A 14. számú vegyület és a 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,21 (1,5H), 1,23 (1,5H), 1,29 (1,5H, s), 1,30 (1,5H, s), 1,75 (0,5H, d, $J=5,4$), 1,87 (0,5H, s), 2,21 (0,5H, dd, $J=7,2$, 5,6), 2,69 (0,5H, dd, $J=7,6$, 5,4), 3,41 (3H, s), 3,82 (1,5H, s), 3,89 (1,5H, s), 4,59 (2H, s), 5,24 (2H, s), 6,31 (0,5H, d, $J=7,8$), 7,19 (0,5H, d, $J=7,2$)

A 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,20 (1,5H, s), 1,22 (1,5H, s), 1,30 (3H, s), 1,78 (0,5H, d, $J=5,6$), 1,92 (0,5H, d, $J=5,4$), 2,19 (0,5H, dd, $J=7,1$, 5,4), 2,29 (3H, t, $J=2,1$), 2,66 (0,5H, dd, $J=7,5$, 5,6), 4,32–4,48 (2H, M), 5,23 (2H, br s), 6,42 (0,5H, d, $J=7,5$), 7,34 (0,5H, d, $J=7,1$)

Az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,24 (1,5H, s), 1,25 (1,5H, s), 1,32 (3H, s), 1,86 (0,5H, d, $J=8,5$), 1,89 (0,5H, d, $J=8,7$), 2,01 (0,5H, dd, $J=9,0$, 8,5), 2,48 (0,5H, dd, $J=8,7$, 7,7), 3,84 (1,5H, s), 3,89 (1,5H, s), 5,23 (2H, br s), 6,99 (0,5H, d, $J=7,7$), 7,10 (1H, tt, $J=9,6$, 7,4), 7,68 (0,5H, d, $J=9,0$)

A 65. számú vegyület és a 90. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,23 (1,5H, s), 1,25 (1,5H, s), 1,32 (3H, s), 1,84 (0,5H, d, $J=8,6$), 1,88 (0,5H, d, $J=8,6$), 2,00 (0,5H, dd, $J=8,9$, 8,6), 2,48 (0,5H, dd, $J=8,6$, 7,9), 3,84 (1,5H, s), 3,89 (1,5H, s), 4,10 (3H, t, $J=1,5$), 5,17 (2H, t, $J=1,4$), 7,00 (0,5H, d, $J=7,9$), 7,68 (0,5H, d, $J=8,9$)

A 214. számú vegyület és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,21 (1,8H, s), 1,23 (1,2H), 1,30 (3H, s), 1,78 (0,4H, d, $J=5,5$), 1,92 (0,6H, d, $J=5,5$), 2,20 (0,6H, dd, $J=7,2$, 5,5), 2,67 (0,4H, dd, $J=7,5$, 5,5), 4,08 (1,2H, t, $J=1,5$), 4,10 (1,8H, t, $J=1,5$), 4,32–4,48 (2H, M), 5,18–5,22 (2H, M), 6,42 (0,4H, d, $J=7,6$), 7,34 (0,6H, d, $J=7,2$)

A 219. számú vegyület és a 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ 1,20 (1,8H, s), 1,23 (1,2H), 1,29 (1,8H, s), 1,31 (1,2H, s), 1,75 (0,4H, d, $J=5,5$),

1,87 (0,6H, d, J=5,5), 2,23 (0,6H, dd, J=7,5, 5,5), 2,73 (0,4H, dd, J=7,8, 5,5), 4,10 (3H, t, J=1,5), 4,52 (1,2H, dt, J=5,8, 1,3), 4,59 (0,8H, dt, J=5,6, 1,4), 5,18–5,33 (4H, M), 5,89–6,07 (1H, M), 6,35 (0,4H, d, J=7,8), 7,24 (0,6H, d, J=7,5).

Az alábbiakban készítménypéldákkal szemléltetjük a találmányt. A készítménypéldákban említett részek tömegrészeket jelentenek, a találmány szerinti vegyületekre pedig az 1–8. táblázatokban megadott számokkal utalunk.

1. készítménypélda

Emulgeálható koncentrátumok

Az 1–200. számú vegyületek mindegyikéből 10 tömeg%-os, emulgeálható koncentrátumot készítünk oly módon, hogy 10 tömegrész, találmány szerinti vegyületet feloldunk 35 tömegrész xilol és 35 tömegrész dimetil-formamid elegyében, majd 14 tömegrész polioxietilén-sztril-fenil-étert és 6 tömegrész kalcium-dodecil-benzolszulfonátot adunk hozzá, és a kapott anyagkeveréket alaposan összekeverjük.

2. készítménypélda

Nedvesíthető porok

Az 1–200. számú vegyület mindegyikéből 20 tömeg%-os, nedvesíthető porkészítményt állítunk elő. 20 tömegrész, találmány szerinti vegyületet hozzáadunk 4 tömegrész nátrium-lauril-szulfát, 2 tömegrész kalcium-ligninszulfonát, szintetikus, hidratált szilícium-dioxid finom porának 20 tömegrész mennyiségé, valamint 54 tömegrész diatomaföld keverékéhez. A kapott anyagkeveréket egy lékeverőben összekeverjük.

3. készítménypélda

Granulátumok

Szintetikus, hidratált szilícium-dioxid finom porából 5 tömegrészt, továbbá 5 tömegrész nátrium-dodecil-benzolszulfonátot, 30 tömegrész bentonitot és 55 tömegrész agyagot hozzáadunk 5 tömegrész találmány szerinti vegyülethez, az 1–200. számú vegyületek mindegyikéhez. A kapott keveréket alapos keveréssel összekeverjük, majd megfelelő mennyiségű vizet adunk hozzá, és tovább keverjük. Az így összekevert anyag szemcseméretét granuláló berendezésben beállítjuk, azután a terméket átáramoltatásos szárítóban megszáritjuk. Ekkor 5 tömeg%-os granulátumot kapunk mindegyik vegyületből.

4. készítménypélda

Porkészítmények

Az 1–200. számú vegyületek mindegyikéből 1 tömeg%-os port készítünk. 1 tömegrész, találmány szerinti vegyületet feloldunk megfelelő mennyiségű acetonban, hozzáadunk 5 tömegrész szintetikus, hidratált szilícium-dioxidot finom por alakjában, valamint 0,3 tömegrész savas izopropil-foszfátot (PAP) és 93,7 tömegrész agyagot. A komponenseket egy lékeverőben összekeverjük, azután az acetont elpárologtatással eltávolítjuk.

5. készítménypélda

Folyékony koncentrátumok

20 tömeg%-os folyékony koncentrátumot készítünk az 1–200. számú vegyületek mindegyikéből 20 tömegrész találmány szerinti vegyületet összekeverünk 1,5 tömegrész szorbitán-trioleáttal és 2 tömegrész poli(vinil-alkohol) 28,5 tömegrész vizes oldatával, és a keveréket finomra őröljük egy homokőrölőben 3 µm vagy annál kisebb szemcse nagyságúra. Hozzáadunk 40 tömegrész vizes oldatot, amely 0,05 tömegrész xantángyantát és 0,1 tömegrész alumínium-magnézium-szilikátot, valamint 10 tömegrész propilén-glikolt tartalmaz. A kapott keveréket homogenizáljuk.

6. készítménypélda

Olajos készítmények

0,1 tömeg%-os, olajos készítményt állítunk elő az 1–200. számú vegyületek mindegyikéből oly módon, hogy 0,1 tömegrész, találmány szerinti vegyületet feloldunk 10 tömegrész diklór-metánban, és a kapott oldatot 89,9 tömegrész, szagtalanított petróleummal keverjük össze.

7. készítménypélda

Olajalapú aeroszolok

Olajalapú aeroszolt készítünk az 1–200. számú vegyületek mindegyikéből oly módon, hogy 1 tömegrész, találmány szerinti vegyületet 5 tömegrész diklór-metánal és 34 tömegrész, szagtalanított petróleummal összekeverve oldatot készítünk, és a kapott oldatot egy aeroszolos palackba töltjük. Az aeroszolos palackra egy szeleprést helyezünk, azután 60 tömegrész hajtóanyagot (cseppfolyósított földgázt) sűrítünk a palackba nyomás alatt, a szeleprészen keresztül.

8. készítménypélda

Vizes alapú aeroszolok

Az 1–200. számú vegyületek mindegyikéből vizes alapú aeroszolt állítunk elő. Összekeverünk 0,6 tömegrész, találmány szerinti vegyületet, 5 tömegrész xilolt, 3,4 tömegrész, szagtalanított petróleumot és 1 tömegrész emulgeálószer (Atmos 300, lajstromozott kereskedelmi név, az Atlas Chemical Corp. gyártmánya). A kapott oldatot 50 tömegrész tiszta vízzel együtt egy aeroszolos palackba töltjük, melyre egy szeleprést helyezünk, azután 40 tömegrész hajtóanyagot (cseppfolyósított földgázt) sűrítünk a palackba nyomás alatt, a szeleprészen keresztül.

9. készítménypélda

Moszkítótercsek

Rovarok és/vagy atkák irtására alkalmas moszkítótercset készítünk moszkítótercsek-alapanyagon, annak impregnálásával. Az alapanyagot úgy állítjuk elő, hogy Tabu por, a morzsika nevű növény (Pyrethrum) törkölye, valamint faliszt 4:3:3 tömegarányú keverékének homogenizálásával kapott moszkítótercsek-vivőanyag 99,5 g mennyiségéhez 120 ml vizet adunk, a kapott keveréket alaposan összegyúrjuk, formázzuk és megszáritjuk. Az alapanyagot a találmány szerinti vegyület 0,5 g-ját

tartalmazó, acetonos oldattal impregnáljuk, az impregnálást az 1–200. számú vegyületek mindegyikének oldatával elvégezve, azután a kapott, impregnált alapanyagot levegőn megszáritjuk.

10. készítménypélda

Elektromos moszkítólapka

0,8 g, találmány szerinti vegyületnek, az 1–200. számú vegyületek mindegyikének és 0,4 g piperonil-butoxidnak a keverékéhez acetont adunk, és 10 ml végtér-fogató oldatot készítünk. Elektromos moszkítólapka-alapanyagra (gyapothulladék és pulp keverékének rostjai koagulálásával kapott lemez), melynek felülete darabonként $2,5 \times 1,5$ cm, és vastagsága 0,3 cm, 0,5 ml fenti oldatot viszünk fel egyenletes impregnálással, amikor is elektromos moszkítólapkát kapunk.

11. készítménypélda

Elektromos szúnyogirtó berendezések inszekticid oldat használatával

Az 1–200. számú vegyületek mindegyikével elektromos szúnyogirtó berendezéseket készítünk, amelyek inszekticid oldatokkal használhatók. 3 tömegrész, találmány szerinti vegyületet feloldunk 97 tömegrész, szagtalanított petróleumban, és az oldatot betöltjük egy PVC palackba. A palackba egy adszorbens kanóc egyik végét illesztjük be úgy, hogy a másik vége egy fűtőszközzel melegíthető legyen. (Az adszorbens kanócot egy szervetlen por és egy kötőanyag egyesítésével és kiégetésével kapjuk.)

12. készítménypélda

Melegíthető füstölőkészítmény

Az 1–200. számú vegyületek mindegyikéből melegíthető füstölőkészítményt állítunk elő. 100 mg, találmány szerinti vegyületet feloldunk megfelelő mennyiségű acetonban, és az oldatot $4,0 \text{ cm}^2$ felületű és 1,2 mm vastagságú, porózus kerámialemezre visszük fel impregnálással.

13. készítménypélda

Mérgező csalétek

10 mg, találmány szerinti vegyületet, az 1–200. számú vegyületek mindegyikét feloldjuk 0,5 ml acetonban. A kapott oldatot egyenletesen összekeverjük 5 g szilárd állattáppal (tenyésztéshez használható CE-2 kereskedelmi nevű, por alakú táp, az Oriental Kobo Co. gyártmánya). A kapott keveréket az aceton eltávolítása végett levegőn megszáritjuk, amikor is 0,2 tömeg%-os, mérgező csalétket kapunk mindegyik találmány szerinti vegyületből.

14. készítménypélda

Atkairtó lapok

A találmány szerinti vegyületeket, az 1–200. számú vegyületek mindegyikét, megfelelő mennyiségű acetonban oldjuk fel. Atkairtó lapokat készítünk a kapott oldattal úgy, hogy nem szőtt kelmét impregnálunk az oldattal, az oldatot a kelmére csepegtetve olyan mennyiségben, hogy a kelme 1 négyzetmétere 1 g hatóanyagot

hordozzon. Az így kezelt kelmét az aceton eltávolítására levegőn megszáritjuk.

15. készítménypélda

Mikrokapszulák

10 tömegrész, találmány szerinti vegyület, az 1–200. számú vegyületek mindegyike, 10 tömegrész fenil-xilil-etán és 0,5 tömegrész Sumidur L-75 (tolilén-diizocianát, a Sumitomo Bayer Urethane Comp. Ltd. gyártmánya) keverékét hozzáadjuk 20 tömegrész, 10 tömeg%-os, vizes arabmézga oldathoz. A kapott keveréket homogenizátorban keverjük, míg $20 \mu\text{m}$, átlagos szemcseméretű emulziót nem kapunk. Ezután 2 tömegrész etilén-glikolt adunk az emulzióhoz. A kapott keveréket forró fürdőn melegítve 60°C -on reagáltatjuk 24 órán át, amikor is mikrokapszulazagyt kapunk. Egyidejűleg 0,2 tömegrész xantángyantát és 1,0 tömegrész Veegum R-t (alumínium-magnézium-szilikát, a Sanyo Chemical Industries Ltd. gyártmánya) diszpergálunk 56,3 tömegrész, ioncserélt vízben, sűrítőszer oldat előállítására végett.

42,5 tömegrész, fentiek szerint előállított mikrokapszulazagyt és 57,5 tömegrész, fentiek szerint előállított sűrítőszeroldatot összekeverve 10 tömeg%-os mikrokapszulákat kapunk.

16. készítménypélda

Melegítés nélkül elpárolgó készítmények

Melegítés nélkül elpárolgó készítményeket állítunk elő az 1–200. számú vegyületek mindegyikével oly módon, hogy $100 \mu\text{m}$, találmány szerinti vegyületet feloldunk megfelelő mennyiségű acetonban, és a kapott oldatot egyenletesen felvisszük egy 2 cm^2 felületű és 0,3 mm vastagságú szűrőpapírra, azután a szűrőpapírt az aceton eltávolítására levegőn megszáritjuk.

A következő kísérleti példák a találmány szerinti vegyületek mint peszticid készítmények hatóanyagainak hatékonyságát mutatják be. A kísérleti példákban a találmány szerinti vegyületekre az 1–8. táblázatokban megadott számaikkal hivatkozunk.

1. kísérleti példa

Inszekticid hatás vizsgálata gyapotbagolyon (Spodoptera litura)

Minden egyes folyékony koncentrátumot, amelynek hatóanyaga a 9., 11., 15., 34., 36., 40., 10., 20., 24., 35., 49. számú vegyület, illetve a 14. számú vegyület és a 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 65. számú vegyület és a 90. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 214. számú vegyület és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke és a 219. számú vegyület és a 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke, amelyeket az 5. készítménypéldában leírt módon állítottunk elő, vízzel felhígítottunk 500 ppm hatóanyag-koncentrációra. 2 ml hígított készítménnyel 13 g mesterséges tápot (Insecta LF, a Nihon Nosan Co. gyártmánya) készí-

tettünk elő egy 11 cm átmérőjű polietilén edényben, amelyben azután a gyapotbagoly 5 db, negyedik fejlődési stádiumú lárváját engedjük el. 6 nap múlva megszámoltuk az elpusztult és az élő lárvákat, és megállapítottuk a mortalitást.

A kísérlet eredményeként azt talápszaltuk, hogy 100%-os mortalitást értünk el a következő találmány szerinti hatóanyagokkal: 9., 11., 15., 34., 36., 40., 10., 20., 24., 35. és 49. számú vegyületek, valamint a 14. és 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. és 48. számú vegyületek 1:1 molarányú keveréke, az 59. és 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. és 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 65. és 90. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 214. és 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke, a 219. és 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke.

2. kísérleti példa

Inszezticid hatás vizsgálata gyapotlevelétetűn (Aphis gossypii)

Uborkanövényeket, amelyek egy polietilén edénybe ültetve már kifejlesztették első valódi levelüket, megfertőztünk egy olyan uborkalevével, amelyen gyapotlevelétetű-paraziták voltak. A megfertőzés után egy nappal folyékony koncentrátumok mindegyikét, amelyek hatóanyaga a 9., 11., 36., 10., 20., 35., 49. számú vegyület, illetve a 14. számú vegyület és a 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 65. számú vegyület és a 90. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 214. és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke és a 219. számú vegyület és a 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke, és amelyeket az 5. készítménypéldában leírt módon állítottunk elő, vízzel felhígítottuk 500 ppm hatóanyag-koncentrációra, és a hígított készítmény 20 ml-et kipermeteztük mindegyik edényre. Hat nappal a permetezés után a populációcsökkentő hatást az alábbi egyenlet alapján számítottuk ki:

populáció-csökkentő hatás = $\{1 - (Cb \times Tai) / (Tb \times Cai)\} \times 100$
ahol Cb a rovarok száma a kezeletlen csoportban, a permetezés előtt

Cai a rovarok száma a kezeletlen csoportban, a permetezés után

Tb a rovarok száma a kezelt csoportban, a permetezés előtt

Tai a rovarok száma a kezelt csoportban, a permetezés után.

A kísérlet eredményeképpen megállapítottuk, hogy 90% vagy annál nagyobb populációcsökkentő hatást mutattak a következő találmány szerinti vegyületek: a 9., 11., 36., 10., 20., 35. és 49. számú vegyület, illetve a 14. számú vegyület és a 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 65. számú vegyület és a 90. számú

vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 214. számú vegyület és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke és a 219. számú vegyület és a 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke.

3. kísérleti példa

Inszezticid hatás vizsgálata háziléggyen (Musca domestica)

5,5 cm átmérőjű, polietilén edények aljára azonos átmérőjű szűrőpapírt helyeztünk. Folyékony koncentrátumkészítményeket, amelyek hatóanyaga a 9., 11., 15., 34., 36., 40., 10., 20., 24., 35., 49. számú vegyület, illetve a 14. számú vegyület és a 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 65. számú vegyület és a 90. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 214. számú vegyület és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke és a 219. számú vegyület és a 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke, amelyeket az 5. készítménypéldában leírt módon állítottunk elő, vízzel felhígítottunk 500 ppm hatóanyag-koncentrációra. A szűrőpapírokra 0,7 ml hígított készítményt csepegtettünk. Táplálékként 30 mg szacharózt helyeztünk el egyenletesen a polietilén edényekben. 10 kifejlett, nőtény háziléggyet engedtünk el a polietilén edényekben, amelyeket egy fedéllel lezártuk. 24 óra múlva megszámoltuk az elpusztult és az élő rovarokat és megállapítottuk a mortalitást.

A kísérletben azt találtuk, hogy 100%-os mortalitást mutattak a következő találmány szerinti vegyületek: a 9., 11., 15., 34., 36., 40., 10., 20., 24., 35. és 49. számú vegyület, illetve a 14. számú vegyület és a 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 65. számú vegyület és a 90. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 214. és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke és a 219. számú vegyület és a 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke.

4. kísérleti példa

Inszezticid hatás vizsgálata német csótányon (Blattella germanica)

5,5 cm átmérőjű, polietilén edények aljára azonos átmérőjű szűrőpapírokat helyeztünk. Folyékony koncentrátumkészítményeket, amelyek hatóanyaga a 9., 11., 15., 34., 36., 40., 10., 20., 24., 35. és 49. számú vegyület, illetve a 14. számú vegyület és a 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 65. számú vegyület és a 90. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 214. és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke és a 219. számú vegyület és a 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke,

amelyeket az 5. készítménypéldában leírt módon állítottunk elő, vízzel felhígítottunk 500 ppm hatóanyag-koncentrációra. A szűrőpapírra 0,7 ml hígított készítményt csepegtetünk. Táplálékként 30 mg szacharózt helyeztünk el egyenletesen a polietilén edényekben. Két kifejtett, hím német csótányt engedtünk el mindegyik polietilén edényben, és az edényeket fedéllel lezártuk. Hat nap elteltével megszámoltuk az elpusztult és az élő egyedeket és megállapítottuk a mortalitást.

A kísérletben azt találtuk, hogy 100%-os mortalitással rendelkeznek az alábbi találmány szerinti vegyületek: a 9., 11., 15., 34., 36., 40., 10., 20., 24., 35. és 49. számú vegyület, valamint a 14. számú vegyület és a 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 65. számú vegyület és a 90. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 214. számú vegyület és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke és a 219. számú vegyület és a 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke.

5. kísérleti példa

Insekticid hatás vizsgálata közönséges szúnyogon (Culex pipiens pallens)

Folyékony koncentrátumkészítmények mindegyikét, amelyek hatóanyaga a 9., 11., 15., 34., 36., 40., 3., 10., 20., 24., 28., 35. és 49. számú vegyület, illetve a 14. számú vegyület és a 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 65. számú vegyület és a 90. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 214. számú vegyület és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke és a 219. számú vegyület és a 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke, amelyeket az 5. készítménypéldában leírt módon állítottunk elő, vízzel felhígítottunk 500 ppm hatóanyag-koncentrációra. 0,7 ml hígított készítményt hozzáadtunk 100 ml ioncserélt vízhez, ezzel a hatóanyag-koncentrációt 3,5 ppm-re állítottuk be. A kapott oldatban elengedték közönséges szúnyog 20 db, utolsó fejlődési stádiumú lárváját. Egy nap múlva megszámoltuk az elpusztult és az élő egyedeket és megállapítottuk a mortalitást.

A kísérletben azt találtuk, hogy 100%-os mortalitást mutatnak az alábbi találmány szerinti vegyületek: a 9., 11., 15., 34., 36., 40., 3., 10., 20., 24., 28., 35. és 49. számú vegyület, valamint a 14. számú vegyület és a 39. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 65. számú vegyület és a 90. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 214. és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke és a 219. számú vegyület és a 244. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke.

6. kísérleti példa

Insekticid hatás vizsgálata ruhamolyon (Tineola bisselliella) közönséges hőmérsékleten való hatóanyag-elpárolgatással

Egy polietilén edény alján elhelyeztünk egy 2 cm²-es gyapjuszövetet és 10 db, közepesen fejlett stádiumú ruhamolylárvát (az edény aljának átmérője 10 cm, szájának átmérője 12,5 cm, magassága 9,5 cm, térfogata 950 cm³). Melegítés nélkül elpárolgó készítmények mindegyikét, amelyek hatóanyaga a 11., 36., 9., 10., 34. és 35. számú vegyület, illetve a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, amelyeket a 16. készítménypéldában leírt módon állítottunk elő, felfüggesztettük az edények fedelére, és az edényeket lezártuk. Az edényeket 25 °C hőmérsékleten egy hétig állni hagytuk, azután felnyitottuk és megszámoltuk a nem élő, a haldokló és az élő rovarokat, és meghatároztuk a haldokló és elpusztult lárvák százalékos arányát. Emellett meghatároztuk a gyapjuszövet rovarfertőzésének mértékét. A molyfertőzés mértékét az alábbi skálán értékeltük:

- +++ : szembetűnő molyfertőzés
- ++ : jelentős molyfertőzés
- + : nem elhanyagolható mértékű molyfertőzés
- ± : csekély molyfertőzés
- : nincs molyfertőzés.

Ezt a kísérletet megismételtük úgy, hogy a találmány szerinti vegyületek helyett referenciavegyületeként az US 4 219 565 számú szabadalmi leírásban ismertetett vegyületeket, nevezetesen a (2,3,4,5,6-pentaklórfenil)metil-(1R)-cisz-3-(ciklobutoxi-imino-metil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilátot (A referenciavegyület) és a (2,3,4,5,6-pentafluor-fenil)metil-(1R)-transz-3-(ciklopentoxi-imino)-metil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilátot (B referenciavegyület) használtuk. A kísérlet eredményeit a 17. táblázatban foglaljuk össze.

17. táblázat

Vegyület	A haldokló és elpusztult lárvák száma	A molyfertőzés mértéke
11	100	-
36	100	-
9	100	+
10	100	-
34	90	+
35	100	-
23. és 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke	100	±
59. és 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke	100	±
61. és 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke	100	±
A	0	+++
B	0	+++

7. kísérleti példa

Moszkítótekercs hatásának vizsgálata közönséges szúnyogon (Culex pipiens pallens)

Egy üvegedényben elengedtünk 20 db, kifejlett nőstény szúnyogot (az edény 70 cm élhosszúságú kocka, térfogata 0,34 m³). Minden egyes inszekticid tekercsből, amelynek hatóanyaga a 9., 10., 11., 15., 34., 35., 36., 40., 20., 24. és 49. számú vegyület, illetve a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, és a 214. és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke, amelyeket a 9. készítménypéldában leírt eljárással állítottunk elő, levágtunk egy 0,3 g-os darabot, majd egyik végén meggyújtottuk és függőlegesen betettük egy tartóba, amely a kamra aljának közepén volt elhelyezve. 30 másodperc égetés után a darabot kivettük a kamrából. A darab behelyezése után 12 perccel megszámoltuk a letaglózott szúnyogokat.

Ugyanezt a kísérletet elvégeztük úgy, hogy a találmány szerinti vegyületek helyett a 6. kísérleti példában említett A referenciavegyületet és B referenciavegyületet használtuk. A kísérlet eredményeit a 18. táblázatban mutatjuk be.

18. táblázat

Vegyület	A letaglózott szúnyogok százalékos aránya
9	95
10	85
11	100
15	100
34	100
35	100
36	100
40	100
20	100
24	100
49	100
61. és 86. számú v. 1:1 molarányú keveréke	100
23. és 48. számú v. 1:1 molarányú keveréke	100
59. és 84. számú v. 1:1 molarányú keveréke	100
214. és 239. számú v. 1:1 molarányú keveréke	95
A	0
B	30

8. kísérleti példa

Olajos készítmény permetezésének hatása házilégyre (Musca domestica)

Egy üvegedényben (70 cm élhosszúságú kocka, térfogata 0,34 m³) elengedtünk 12 db, kifejlett házilégyet

10/10 him-nőstény arányban. Minden egyes olajos készítményből, amelynek hatóanyaga a 9., 10., 11., 15., 34., 35., 36., 40., 20., 24. és 49. számú vegyület, illetve a 61. számú vegyület és a 86. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, a 23. számú vegyület és a 48. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, az 59. számú vegyület és a 84. számú vegyület 1:1 molarányú keveréke, és a 214. és a 239. számú vegyület 3:2 molarányú keveréke, amelyeket a 6. készítménypéldában leírt eljárással állítottunk elő, 0,7 ml-t permeteztünk a kamrába egy porlasztóval, 0,9 kg/cm² nyomáson. A bepermetezés után 5 perccel megszámoltuk a letaglózott házilégeket.

A kísérletet megismételtük oly módon, hogy a találmány szerinti vegyületek helyett a 7. kísérleti példában említett A referenciavegyületet és B referenciavegyületet használtuk. A kísérlet eredményeit a 19. táblázatban mutatjuk be.

19. táblázat

Vegyület	A letaglózott szúnyogok százalékos aránya
9	90
10	80
11	100
15	80
34	70
35	100
36	95
40	90
20	90
24	80
49	75
61. és 86. számú v. 1:1 molarányú keveréke	100
23. és 48. számú v. 1:1 molarányú keveréke	80
59. és 84. számú v. 1:1 molarányú keveréke	90
214. és 239. számú v. 1:1 molarányú keveréke	100
A	0
B	35

A találmány szerinti vegyületek használata kiváló 50 kártevőirtó hatást biztosít.

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Észtervegyületek, melyek a (2) általános képletnek felelnek meg, ahol
- R jelentése hidrogénatom, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített, 1–3 szénatomos alkilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített allilcsoport,

- vagy helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített propargilcsoport,
- X jelentése hidrogénatom, halogénatom, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített, 1-3 szénatomos alkilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített, 2-3 szénatomos alkenilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített, 2-3 szénatomos alkinilcsoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített, 1-3 szénatomos alkoxics csoport, helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített, 1-3 szénatomos alkil-tio-csoport vagy (1-3 szénatomos alkoxi)-metil-csoport, amely helyettesítetlen vagy egy vagy több halogénatommal helyettesített az alkoxirészben.
2. Az 1. igénypont szerinti észtervegyületek, amelyek az 1-helyzetben R konfigurációjú ciklopropángyűrűt tartalmaznak.
3. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti észtervegyületek, amelyek az 1-helyzetben és a 3-helyzetben szubsztituált,

az 1-helyzetben a 3-helyzetű szubsztituenshez képest transz-konfigurációjú szubsztituenszt tartalmazó ciklopropángyűrűt tartalmaznak.

4. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti észtervegyületek, amelyek az 1-helyzetben és a 3-helyzetben szubsztituált, az 1-helyzetben a 3-helyzetű szubsztituenshez viszonyítva cisz-konfigurációjú szubsztituenszt tartalmazó ciklopropángyűrűt tartalmaznak.
5. Az 1. igénypont szerinti észtervegyületek, amelyek képletében R jelentése metilcsoport.
6. Az 1. igénypont szerinti észtervegyületek, amelyek képletében X jelentése hidrogénatom.
7. Az 1. igénypont szerinti észtervegyületek, amelyek képletében X jelentése metilcsoport.
8. Az 1. igénypont szerinti észtervegyületek, amelyek képletében X jelentése metoxics csoport.
9. Insekticid készítmény, amely hatóanyagként egy 1. igénypont szerinti észtervegyület hatásos mennyiségét tartalmazza, a szokásos formálási segédanyagok mellett.

